

(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2002年12月5日 (05.12.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/096882 A1

(51) 國際特許分類⁷: C07D 231/14, 213/81, 285/06, 239/28, 307/68, 277/56, 261/18, 275/02, 333/40, 207/416, 213/82, 333/38, C07C 211/52, 215/68, 217/76, A01N 37/22, 43/40, 43/56 [JP/JP]; 〒 586-0024 大阪府 河内長野市 西之山町 1-28-305 Osaka (JP). 竹元 刚 (TAKEMOTO,Tsuyoshi) [JP/JP]; 〒 586-0024 大阪府 河内長野市 西之山町 1-28-402 Osaka (JP). 藤岡 伸祐 (FUJIOKA,Shinsuke) [JP/JP]; 〒 586-0037 大阪府 河内長野市 上原町 474-1-103 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP02/05285

(22) 国際出願日: 2002年5月30日 (30.05.2002)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願2001-164787 2001年5月31日 (31.05.2001) JP

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 日本農薬株式会社 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒 103-8236 東京都中央区日本橋1丁目2番5号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人(米国についてのみ): 古谷 敬 (FURUYA,Takashi) [JP/JP]; 〒 598-0021 大阪府 泉佐野市 日根野2821-1 Osaka (JP). 山口 実 (YAMAGUCHI,Minoru) [JP/JP]; 〒 589-0008 大阪府 大阪狭山市 池尻自由丘1-4-3-402 Osaka (JP). 遠西 正範 (TOHNISHI,Masanori) [JP/JP]; 〒 599-8241 大阪府 堺市 福田1040-1-408 Osaka (JP). 瀬尾 明 (SEO,Akira) [JP/JP]; 〒 648-0092 和歌山県 橋本市 紀見ヶ丘2-3-19 Wakayama (JP). 森本 雅之 (MORIMOTO,Masayuki)

(74) 代理人: 浅村 皓, 外 (ASAMURA,Kiyoshi et al.); 〒 100-0004 東京都千代田区 大手町2丁目2番1号 新大手町ビル331 Tokyo (JP).

(81) 指定国(国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

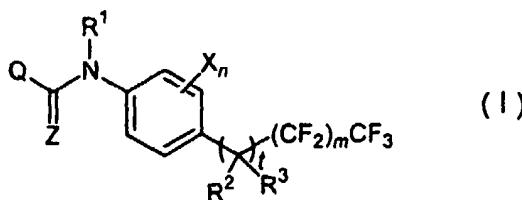
(84) 指定国(広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 國際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイドスノート」を参照。

(54) Title: SUBSTITUTED ANILIDE DERIVATIVES, INTERMEDIATES THEREOF, AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL CHEMICALS, AND THEIR USAGE

(54) 発明の名称: 置換アニリド誘導体、その中間体及び農園芸用薬剤並びにその使用方法



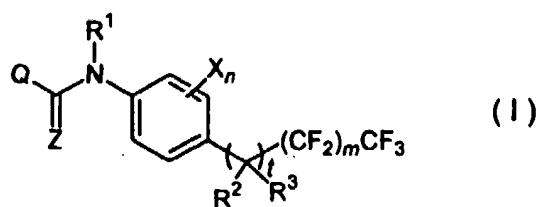
(57) Abstract: Substituted anilide derivatives represented by the general formula (1), intermediates thereof, agricultural and horticultural chemicals, and their usage: (1) wherein R^1 is hydrogen, C_{1-6} alkyl, C_{1-6} haloalkyl, or the like; R^2 is hydrogen, halogeno, or C_{1-6} haloalkyl; R^3 is hydrogen, halogeno, C_{1-6} alkyl, or the like; t is 0 or 1; m is an integer of 0 to 6; when t is 0, X is C_{2-8} alkyl, C_{1-8} alkoxy, or the like, while when t is 1, X is halogeno, cyano, or the like; n is an integer of 1 to 4; Z is O or S; and Q is Q1 to Q25.

[統葉有]



(57) 要約:

本発明は、一般式(I)



(式中、R¹は水素原子、C₁~C₆アルキル基、ハロC₁~C₆アルキル基等を示し；R²は水素原子、ハロゲン原子又はハロC₁~C₆アルキル基を示し；R³は水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₆アルキル基等を示し；tは0又は1を示し；mは0~6の整数を示し；tが0のときXはC₂~C₈アルキル基、C₁~C₈アルコキシ基等を示し、tが1のときXはハロゲン原子、シアノ基等を示し；nは1~4の整数を示し；ZはO又はSを示し；QはQ 1~Q 25を示す)

で表される置換アニリド誘導体、その中間体及び農園芸用薬剤並びにその使用方法に関するものである。

明細書

置換アニリド誘導体、その中間体及び農園芸用薬剤並びにその使用方法

5 技術分野

本発明は置換アニリド誘導体、その中間体及び該化合物を有効成分とする農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤、殺菌剤又は殺ダニ剤並びにその使用方法に関するものである。

背景技術

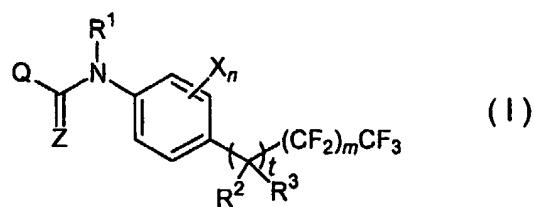
10 特開平5-221994号公報や、特開平10-251240号公報に本発明の置換アニリド誘導体に類似した化合物が農園芸用殺菌剤として有用であることが記載されている。

農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害は今なお大きく、既存薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤の開発が望まれている。又、就農者の老齢化等により各種の省力的施用方法が求められるとともに、これらの施用方法に適した性格を有する農園芸用薬剤の創出が求められている。

発明の開示

本発明者等は新規な農園芸用薬剤を開発すべく銳意研究を重ねた結果、本発明の一般式(II)で表される置換アニリン誘導体が文献未記載の新規化合物であり、該化合物は医薬、農薬等の生理活性を有する各種誘導体を製造する上で有用な中間体であることを見いだし、更に該化合物から誘導される一般式(I)で表される置換アニリド誘導体が文献未記載の新規化合物であり、農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫、殺菌又は殺ダニ剤として有用であることを見いだし、本発明を完成させたものである。

即ち、本発明は一般式(I)



{式中、R¹は水素原子、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルカルボニル基、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

R²は水素原子、ハロゲン原子又はハロC₁-C₆アルキル基を示す。

R³は水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルコキシC₁-C₃アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシC₁-C₃アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₃アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルキルチオC₁-C₃アルコキシ基、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₃アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₃アルコキシ基、C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₃アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₃アルコキシ基、モノC₁-C₆アルキルアミノC₁-C₃アルコキシ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、アミノC₁-C₃アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、アミノ基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルチオアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルチオアミノ基、

ルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニ

5 ルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、

10 同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 ア

15 ルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、

20 ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 ア

25 ルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、フェニル C_1 - C_6 アルコキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル

スルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上有する置換フェニルC₁-C₆アルコキシ基を示す。

5 tは0または1を示し、mは0～6の整数を示す。

t が 0 のとき、X は同一又は異なっても良く、 C_2-C_8 アルキル基、 C_1-C_8 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基又は同一若しくは異なっても良いジ C_1-C_6 アルキ

10 ルアミノC₁~C₆アルキル基を示し、nは1~4の整数を示す。

t が 1 のとき、X は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、 C_1-C_8 アルキル基、ハロ C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、ハロ C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、ハロ C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_6 シクロアルキル基、 C_3-C_6 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_8 アルコキシ基、ハロ

20 C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニル C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオカルボニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルキル基、モフ C_1-C_6 アルキルアミ

25 NO_2 、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル基、同一又は異なっても良いジ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルアミノ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル基、ハロ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルコキシ基、ハロ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルコキシ基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルチオ基、ハロ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルチオ基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルスルフィニル基、ハロ $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルスルフィニル基、 $\text{C}_1\text{-C}_6$

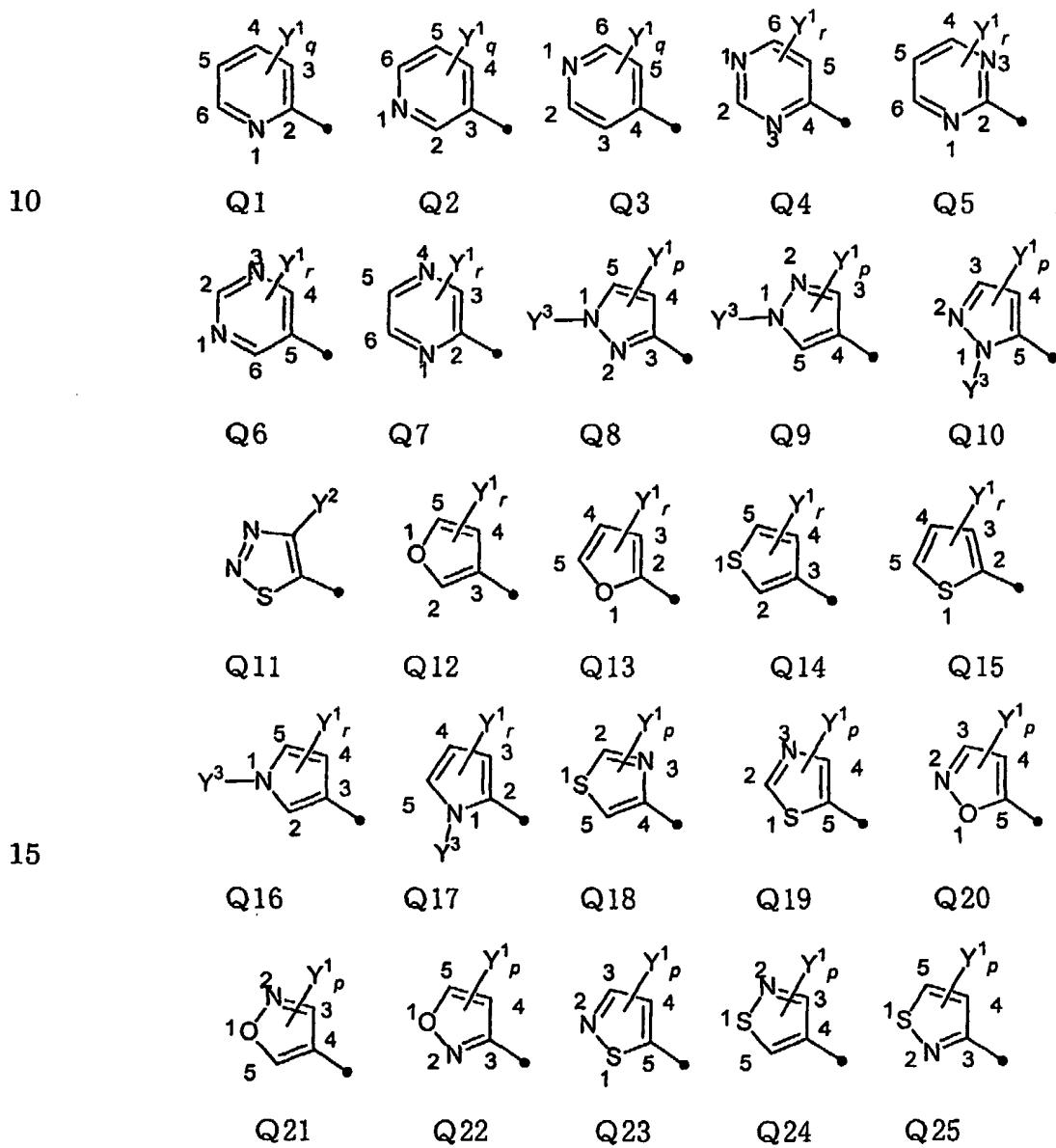
アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキ
ルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アル
コキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、
フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
5 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6
アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 ア
ルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキ
ルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ
10 基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシ
カルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニ
ルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 -
 C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アル
コキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキ
ルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスル
15 ホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、
同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカル
ボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基
又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 -
 C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アル
20 コキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキ
ルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスル
ホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、
同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカル
ボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示し、nは1～
25 4の整数を示す。

又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、
該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 -
 C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アル
コキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキ

ルスルフィニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルフィニル基、C₁~C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルホニル基、モノC₁~C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁~C₆アルキルアミノ基又はC₁~C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。又、XはR¹と5結合して、1~2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5~8員環を形成することができる。

Zは酸素原子又は硫黄原子を示す。

QはQ1~Q25で表される置換基を示す。



(式中、Y¹は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、

C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_2-C_6 アルケニル基、ハロ C_2-C_6 アルケニル基、 C_2-C_6 アルキニル基、ハロ C_2-C_6 アルキニル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキ

10 ルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキ

15 ル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基か

20 ら選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ

25 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

又、芳香環上の隣接した2個の Y^1 は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、

C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。

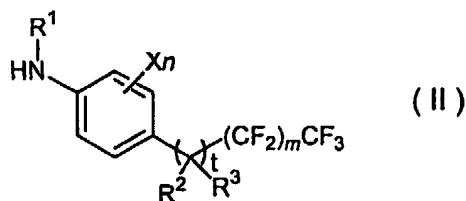
Y^2 は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、 C_1-C_6

アルキルスルホニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルホニル基、モノC₁~C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁~C₆アルキルアミノ基又はC₁~C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

5 Y³は水素原子、C₁~C₆アルキル基、ハロC₁~C₆アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハログン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁~C₆アルキル基、ハロC₁~C₆アルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、ハロC₁~C₆アルコキシ基、C₁~C₆アルキルチオ基、ハロC₁~C₆アルキルチオ基、C₁~C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルフィニル基、C₁~C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルホニル基、モノC₁~C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁~C₆アルキルアミノ基又はC₁~C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

pは0~2の整数を示し、qは0~4の整数を示し、rは0~3の整数を示す。)を示す。)

15 で表される置換アニリド誘導体及び農園芸用薬剤並びにその使用方法に関するものであり、更には置換アニリド誘導体を製造するための中間体化合物である一般式(II)



(式中、R¹は水素原子、C₁~C₆アルキル基、ハロC₁~C₆アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハログン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁~C₆アルキル基、ハロC₁~C₆アルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、ハロC₁~C₆アルコキシ基、C₁~C₆アルキルチオ基、ハロC₁~C₆アルキルチオ基、C₁~C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルフィニル基、C₁~C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルホニル基、モノC₁~C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁~C₆アルキルアミノ基又はC₁~C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

R^2 は水素原子、ハロゲン原子又はハロ C_1-C_6 アルキル基を示す。

R^3 は水素原子、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ基、

5 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルコキシ基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルコキシ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキル

10 アミノ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、

15 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシ

20 カルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスル

25 ホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6

アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシ基、

5 カルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキ

10 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、フェニル C_1 - C_6 アルコキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、

15 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキ

20 ルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1 - C_6 アルコキシ基を示す。

t は1を示し、 m は0から6の整数を示す。

X は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、 C_1 - C_8 アルキル基、ハロ C_1 - C_8 アルキル基、 C_2 - C_8 アルケニル基、ハロ C_2 - C_8 アルケニル基、 C_2 - C_8 アルキニル基、ハロ C_2 - C_8 アルキニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_8 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_8 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニル C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルチオカルボニル C_1 -

C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルキル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6

5 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキル

10 スルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示し、nは1～4の整数を示す。

又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。)で表される置換アニリン誘導体に関するものである。

発明を実施するための形態

本発明の置換アニリド誘導体の一般式(I)の定義において「ハロゲン原子」とは、塩素原子、臭素原子、沃素原子又はフッ素原子を示し、「n-」とはノルマルを、「s-」とはセカンダリーを、「t-」とはターシャリーを、「i-」とはイソを示し、「 C_1-C_6 アルキル」とは、例えばメチル、エチル、n-プロピル、i-プロピル、n-ブチル、i-ブチル、s-ブチル、t-ブチル、n-ペンチル、n-ヘキシル等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示し、「ハロ C_1-C_6 アルキル」とは、同一又は異なっても良い1以上のハロ

ゲン原子により置換された直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1～6個のアルキル基を示し、「C₃～C₆シクロアルキル」とは、例えばシクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等の環状の炭素原子数3～6個のアルキル基を示す。

5 「複素環基」とは、酸素原子、硫黄原子又は窒素原子から選択される1以上のヘテロ原子を有する5又は6員複素環基を示し、例えばピリジル基、ピリジン-
N-オキシド基、ピリミジニル基、フリル基、テトラヒドロフリル基、チエニル基、テトラヒドロチエニル基、テトラヒドロピラニル基、テトラヒドロチオピラニル基、オキサゾリル基、イソキサゾリル基、オキサジアゾリル基、チアゾリル基、イソチアゾリル基、チアジアゾリル基、イミダゾリル基、トリアゾリル基、ピラゾリル基等を例示することができ、「縮合環」としては、例えばナフタレン、テトラヒドロナフタレン、インデン、インダン、キノリン、キナゾリン、インドール、インドリン、クロマン、イソクロマン、ベンゾジオキサン、ベンゾジオキソール、ベンゾフラン、ジヒドロベンゾフラン、ベンゾチオフェン、ジヒドロベンゾチオフェン、ベンゾオキサゾール、ベンゾチアゾール、ベンズイミダゾール、インダゾール等を例示することができる。

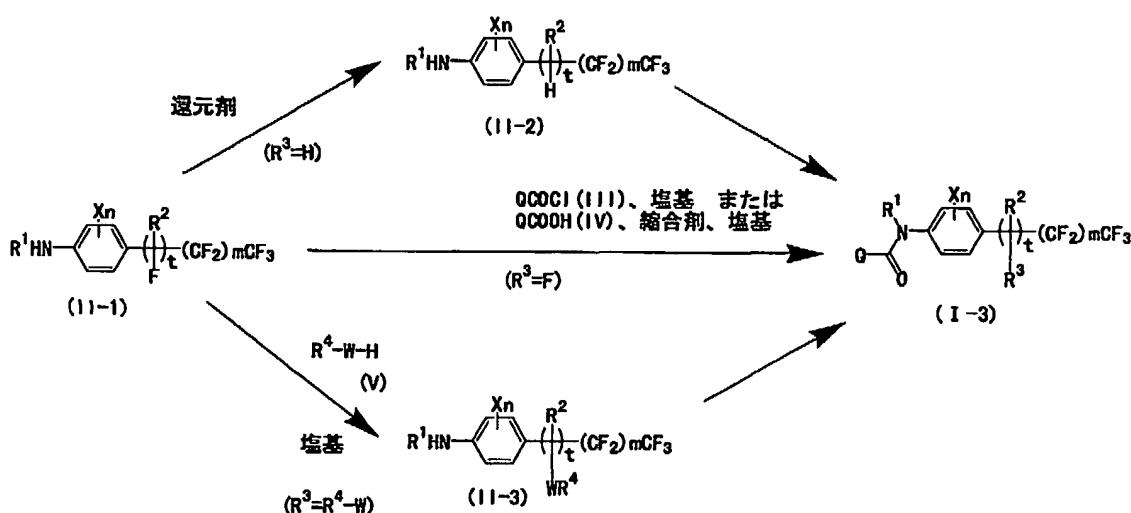
本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体は、その構造式中に1つ又は複数個の不斉中心を含む場合があり、2種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体は、その構造式中に炭素-炭素二重結合に由来する2種の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体のうち、Qとして好ましくは、Q9、Q14、Q15であり、特に好ましくはQ9であり、Y¹として好ましくはハロゲン原子又はC₁～C₂アルキル基であり、特に好ましくは3,5-ジメチル基であり、Y³として好ましくはC₁～C₃アルキル基又はフェニル基であり、特に好ましくはメチル基であり、X_nとして好ましくは2位C₅～C₇アルキル基であり、特に好ましくは2位C₆アルキル基であり、Zとして特に好ましく

は酸素原子であり、R¹として特に好ましくは水素原子であり、R²として特に好ましくはトリフルオロメチル基であり、R³として好ましくは水素原子、ハロゲン原子、C₁~C₂アルコキシ基であり、特に好ましくは水素原子であり、mとして特に好ましくは0であり、tとして特に好ましくは1である。

5 以下に本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体の代表的な製造方法を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

製造方法1.



(式中、R¹、R²、R³、X、m、n、t及びQは前記に同じくし、R⁴は
10 水素原子、C₁~C₆アルキル基、ハロC₁~C₆アルキル基、フェニル基、置換フェニル基、フェニルC₁~C₄アルキル基、Wは-O-、-S-又は-N(R⁴)-
(式中、R⁴は前記に同じ。)を示す。)

一般式(I)で表される置換アニリド誘導体のうち、ZがOで表される置換アニリド誘導体(I-3)は、一般式(II-1)~一般式(II-3)で表されるアニリン誘導体と一般式(III)で表されるヘテロ環カルボン酸クロリドを塩基の存在下又は不存在下に、不活性溶媒中で反応させることにより、又は一般式(II-1)~一般式(II-3)で表されるアニリン誘導体と一般式(IV)で表されるヘテロ環カルボン酸を縮合剤の存在下に、塩基の存在下又は不存在下、不活性溶媒中で反応させることにより製造することができるが、通常のアミド類の製造方法であれば
15 良い。

一般式(II-2)で表されるアニリン誘導体は、一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体を還元剤の存在下、不活性溶媒中で還元することにより製造することができる。

一般式(II-3)で表されるアニリン誘導体は、一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体を塩基の存在下又は不存在下、不活性溶媒中で一般式(V)で表されるアルコール誘導体、チオール誘導体又はアミン誘導体と反応させることにより製造することができる。

一般式(II-1)→一般式(II-2).

本反応で使用できる還元剤としては、水素化リチウムアルミニウム、水素化ホウ素リチウム、水素化ホウ素ナトリウム、ジイソブチルアルミニウムヒドリド、水素化ビス(2-メトキシエトキシ)アルミニウムナトリウム、水素化ホウ素ナトリウム等の金属水素化物、金属リチウム等の金属又は金属塩等を例示することができ、その使用量は一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体に対して当量乃至過剰量の範囲から適宜選択して使用すれば良い。

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至50時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。又、反応系から目的物を単離せずに次の反応工程に供することも可能である。

一般式(II-1)→一般式(II-3).

本反応で使用できる塩基としては水素化リチウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム等の金属水素化物、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム t -ブロトキシド等の金属アルコラート類、 n -ブチルリチウム、 s -ブチルリチウム、 t -ブチルリチウム等のアルキル金属類を例示することができ、その使用量は一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体に対して当量乃至過剰量の範囲から適宜選択して使用すれば良い。

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、メタノール、エタノール等のアルコール類、ジエチルエーテル、1, 2-ジメトキシエタン、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上混合して使用することができる。

反応温度は-70°C乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至50時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。又、反応系から目的物を単離せずに次の反応工程に供することも可能である。

一般式(II-1)、一般式(II-2)又は一般式(II-3)→一般式(I-3).

本反応で使用する縮合剤としては、例えばシアノリン酸ジエチル(DEPC)、カルボニルジイミダゾール(CDI)、1, 3-ジシクロヘキシルカルボジイミド(DCC)、クロロ炭酸エステル類、ヨウ化2-クロロ-1-メチルピリジニウム等を例示することができる。

本反応で使用する塩基としては、無機塩基又は有機塩基が挙げられ、無機塩基としては、例えば水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属原子の水酸化物や水素化ナトリウム、水素化カリウム等のアルカリ金属の水素化物、ナトリウムエトキシド、カリウム t -ブロトキシド等のアルコールのアルカリ金属塩、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の炭酸塩類、有機塩基と

しては、例えばトリエチルアミン、ピリジン、DBU等を例示することができ、その使用量は一般式(IV)で表されるヘテロ環カルボン酸誘導体に対して等モル乃至過剰モルの範囲から選択して使用すれば良い。

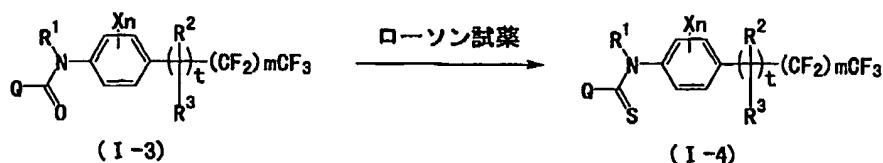
本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないもの
5 であれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩
化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベン
ゼン、ジクロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、
ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等の
10 エステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、ジメ
チルスルホキシド、1,3-ジメチル-2-イミダゾリジノン及びアセトン、メ
チルエチルケトン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は
15 単独で又は2種以上混合して使用することができる。

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いかれ
かの反応剤を過剰に使用することもでき、反応温度は室温乃至使用する不活性溶
15 媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しない
が、数分乃至48時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造する
ことができる。

20 本反応の原料化合物である一般式(II-1)で表されるアニリン誘導体は、特開
平11-302233号公報又は特開2001-122836号公報に開示の製
造方法で製造することができる。

製造方法2.



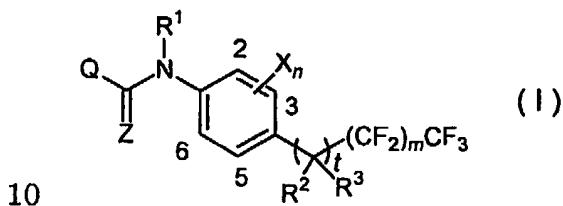
25 (式中、R¹、R²、R³、X、m、n、t及びQは前記に同じ。)

一般式(I)で表される置換アニリド誘導体のうち、ZがSで表される置換アニリド誘導体(I-4)は、(I-3)で表されるアニリン誘導体を公知の方法

(Tetrahedron Lett., 21 (42), 4061 (1980)) に準じてローソン試薬と反応させることにより製造することができる。

一般式(I) で表される置換アニリド誘導体の代表的な化合物を第1表乃至第4表に、また一般式(II) で表される置換アニリン誘導体の代表的な化合物を第6表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。尚、第1表乃至第4表及び第6表中の物性は融点°C又は屈折率 (°C) を示し、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「Bu」はブチル基を、「Ph」はフェニル基を示す。

一般式 (I)



第1表 (Q=Q 9、R¹=H、R²=CF₃、Z=O、t=1)

No.	X n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-1	2-Me	3-CF ₃	Me	0	F	146-148
1-2	2-Et-6-s-Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	119
1-3	2-n-Pr	3-CF ₃	Me	0	F	152-153
1-4	2-n-Pr	3-Me-5-Cl	Me	0	H	85-87
1-5	2-i-Pr	3-CF ₃	Me	0	F	170-172
1-6	2-i-Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	
1-7	2-i-Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-8	2-s-Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	106
1-9	2-s-Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-10	2-t-Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	H	124-125
1-11	2-t-Bu	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-12	2-(CH ₂) ₄ -3	3-CF ₃	Me	0	F	125-128
1-13	2-(CH ₂) ₄ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	F	
1-14	2-(CH ₂) ₄ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	H	165-166
1-15	2-(CH ₂) ₄ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-16	2-CH=CH-CH=CH-3	3-Me-5-Cl	Me	0	F	

第1表 (続き)

No.	X n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-17	2-CH=CH-CH=CH-3	3-Me-5-Cl	Me	0	H	130-131
1-18	2-CH=CH-CH=CH-3	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-19	2-Ph	3-CF ₃	Me	0	F	139-140
1-20	2-Ph	3-Me-5-Cl	Me	0	H	145-147
1-21	2-CH(Me)CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	F	121
1-22	2-CH(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₃	3-Me-5-Cl	Me	0	H	82-83
1-23	2-CH(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₃	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	1.4983(19.1)
1-24	2-CH(Me)CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	0	F	
1-25	2-CH(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₃	3, 5-Me ₂	Me	0	H	1.5051(20.1)
1-26	2-CH(Me)CH ₂ CH ₂ CH ₃	3, 5-Me ₂	Me	0	OMe	1.4921(20.2)
1-27	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	H	Me	0	H	
1-28	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Me	0	F	138-139
1-29	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Et	0	H	
1-30	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Me	0	H	146-147
1-31	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Me	0	OMe	
1-32	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	Me	0	OEt	
1-33	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	CHF ₂	0	H	1.4650(19.9)
1-34	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	0	H	1.4970(19.9)
1-35	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Et	Me	0	H	35-38
1-36	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-i-Pr	Me	0	H	45-47
1-37	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-F	Me	0	H	

第1表 (続き)

No.	X _n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-38	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Me	0	H	
1-39	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Br	Me	0	H	1.5111(22.2)
1-40	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-I	Me	0	H	アモルファス
1-41	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-SMe	Me	0	H	129-130
1-42	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-SOMe	Me	0	H	
1-43	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-SO ₂ Me	Me	0	H	
1-44	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-OMe	Me	0	H	102-105
1-45	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-Me	Me	0	H	1.4790(25.2)
1-46	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-SMe	Me	0	H	1.6201(16.8)
1-47	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-SOMe	Me	0	H	1.4930(23.7)
1-48	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-SO ₂ Me	Me	0	H	48
1-49	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-F	Me	0	H	
1-50	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-Cl	Me	0	H	
1-51	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-Cl	Et	0	H	1.5110(21.7)
1-52	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-Cl	CH ₂ CH ₂ F	0	H	1.4931(22.5)
1-53	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-Br	Me	0	H	
1-54	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-Br	Et	0	H	1.5061
1-55	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-Br	t-Bu	0	H	67-68
1-56	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-I	Me	0	H	119-120
1-57	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-I	Et	0	H	132-133
1-58	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-I	t-Bu	0	H	98-99
1-59	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	5-I	Ph	0	H	127-128
1-60	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl-5-Me	Me	0	H	95-97

第1表 (続き)

No.	X _n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-61	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Br-5-Me	Me	0	H	1.5208(21.1)
1-62	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-I-5-Me	Me	0	H	1.5252(21.1)
1-63	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-I-5-Me	Et	0	H	170-171
1-64	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	0	F	
1-65	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	0	H	1.4974(22.8)
1-66	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	0	OMe	
1-67	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	1	F	
1-68	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	1	H	
1-69	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-F	Me	1	OMe	
1-70	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	F	88-90
1-71	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	H	1.5025(23.7)
1-72	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	アモルファス
1-73	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	OEt	1.5003(15.7)
1-74	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	1	F	
1-75	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	1	H	
1-76	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	1	OMe	
1-77	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	1	OEt	
1-78	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Et	0	H	1.4905(21.2)
1-79	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Et	0	OMe	
1-80	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Et	0	OEt	
1-81	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Br	Me	0	H	134-135
1-82	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Br	Me	0	OMe	96-97
1-83	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Br	Et	0	OH	1.5140(22.2)

第1表 (続き)

No.	X n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-84	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Br	Et	0	H	153-155
1-85	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Et-5-Br	Me	0	H	110-112
1-86	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Et-5-Br	Me	0	OMe	アモルファス
1-87	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-I	Me	0	H	184-185
1-88	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-I	Me	0	OMe	
1-89	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-I	Et	0	H	174
1-90	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SMe	Me	0	H	1.5140(22.2)
1-91	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SMe	Me	0	OMe	
1-92	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SOMe	Me	0	H	42-43
1-93	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SOMe	Me	0	OMe	
1-94	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SO ₂ Me	Me	0	H	1.4993(22.1)
1-95	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-SO ₂ Me	Me	0	OMe	
1-96	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-OMe	Me	0	H	1.5020(20.9)
1-97	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-OMe	Me	0	OMe	
1-98	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-OPh	Me	0	H	1.5182(20.5)
1-99	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-OPh	Me	0	OMe	
1-100	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-OMe-5-Br	Me	0	H	143-144
1-101	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-OMe-5-SPr-n	Me	0	H	102
1-102	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃ -5-Cl	Et	0	H	
1-103	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃ -5-Cl	Me	0	H	102-104

第1表 (続き)

No.	X n	Y ¹ _o	Y ³	m	R ³	物性
1-104	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃ -5-Cl	Me	O	OMe	1.4712(18.2)
1-105	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃ -5-OPh	Me	O	H	1.4951(19.4)
1-106	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	O	F	81-82
1-107	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	O	H	1.4958(15.7)
1-108	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	O	OMe	94-96
1-109	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	O	OEt	1.4958(20.1)
1-110	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	1	F	
1-111	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	1	H	
1-112	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	1	OMe	
1-113	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	1	OEt	
1-114	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Et	O	F	1.4950(18.4)
1-115	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Et	O	H	
1-116	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Et	O	OMe	
1-117	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Et	O	OEt	
1-118	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	n-Pr	O	F	1.4907(19.2)
1-119	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	n-Pr	O	H	1.4970(17.4)
1-120	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	n-Pr	O	OMe	
1-121	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	n-Pr	O	OEt	
1-122	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Ph	O	F	
1-123	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Ph	O	H	
1-124	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Ph	O	OMe	
1-125	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Ph	O	OEt	
1-126	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-F ₂	Me	O	F	

第1表 (続き)

No.	X _n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-127	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-F ₂	Me	0	H	
1-128	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-F ₂	Me	0	OMe	
1-129	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Cl ₂	Me	0	H	73
1-130	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Cl ₂	Me	0	OMe	
1-131	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Cl ₂	Et	0	H	129-130
1-132	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Et-5-Cl	Me	0	H	アモルファス
1-133	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-n-Pr-5-Cl	Me	0	H	1.4890(21.5)
1-134	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-i-Pr-5-Cl	Me	0	H	1.4822(20.3)
1-135	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-t-Bu-5-Cl	Me	0	H	1.4881(20.3)
1-136	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	F	
1-137	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	H	
1-138	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-139	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	1	F	
1-140	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	1	H	
1-141	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₂ -3	3-Me-5-Cl	Me	1	OMe	
1-142	2-CH(Me)(CH ₂) ₃ Me	3-Me-5-Cl	Me	0	F	1.4931(19.5)
1-143	2-CH(Me)(CH ₂) ₃ Me	3-Me-5-Cl	Me	0	H	1.5020(19.5)
1-144	2-CH(Me)(CH ₂) ₃ Me	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	1.5003(19.6)
1-145	2-CH(Me)(CH ₂) ₂ CH Me ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	F	1.4907(20.3)
1-146	2-CH(Me)(CH ₂) ₂ CH Me ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	H	1.4905(20.4)
1-147	2-CH(Me)(CH ₂) ₂ CH Me ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	

第1表 (続き)

No.	X _n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ³	物性
1-148	2-CH(Me)(CH ₂) ₂ CH Me ₂	3, 5-Me ₂	Me	0	F	アモルファス
1-149	2-CH(Me)(CH ₂) ₂ CH Me ₂	3, 5-Me ₂	Me	0	H	
1-150	2-CH(Me)(CH ₂) ₂ CH Me ₂	3, 5-Me ₂	Me	0	OMe	
1-151	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂ -3-Me	3, 5-Me ₂	Me	0	F	1.4904(25.5)
1-152	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂ -3-Me	3, 5-Me ₂	Me	0	H	1.4863(25.5)
1-153	2-CH(Me)CH ₂ CH(Me)CH ₂ CH ₃	3-Me-5-Cl	Me	0	OMe	
1-154	2-C(Me)=CHCHMe ₂ -3-Me	3, 5-Me ₂	Me	0	F	1.4950(25.5)
1-155	2-C(Me)=CHCHMe ₂ -3-Me	3, 5-Me ₂	Me	0	H	1.5052(25.2)
1-156	2-CH(Me)CH ₂ CH(Me)CH ₂ CH ₃	3, 5-Me ₂	Me	0	OMe	
1-157	2-CH(Me)Ph	3, 5-Me ₂	Me	0	F	
1-158	2-CH(Me)Ph	3, 5-Me ₂	Me	0	H	
1-159	2-CH(Me)Ph	3, 5-Me ₂	Me	0	OMe	
1-160	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₃	3, 5-Me ₂	Me	0	F	
1-161	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₃	3, 5-Me ₂	Me	0	H	
1-162	2-CH(Me)CH ₂ CMe ₃	3, 5-Me ₂	Me	0	OMe	
1-163	2, 3-Me ₂	3, 5-Me ₂	Me	0	F	132-136
1-164	2, 3-Me ₂	3, 5-Me ₂	Me	0	H	167-170

第2表 (Q=Q 9、R¹=H、Z=O, t=1)

No.	X n	Y ¹ _p	Y ³	m	R ²	R ³	物性
2-1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	0	F	F	
2-2	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	0	H	H	
2-3	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	2	F	F	
2-4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	2	H	H	
2-5	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	4	F	F	
2-6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	4	H	H	
2-7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	6	F	F	
2-8	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	Me	6	H	H	
2-9	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	F	F	
2-10	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	0	H	H	
2-11	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	2	F	F	
2-12	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	2	H	H	
2-13	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	4	F	F	
2-14	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	4	H	H	
2-15	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	6	F	F	
2-16	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-5-Cl	Me	6	H	H	

第3表 (R¹=H、R²=CF₃、Z=O、m=0、t=1)

No	Q	X n	Y ¹ _{p, q, r} 又はY ²	R ³	物性
3-1	Q 1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	H	
3-2	Q 1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Cl ₂	H	108-109
3-3	Q 2	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-CF ₃	H	1.4860 (22.7)
3-4	Q 2	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-Cl	H	68
3-5	Q 2	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-Cl-6-Me	H	アモルファス
3-6	Q 3	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-CF ₃	H	
3-7	Q 3	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 6-Cl ₂	H	1.5182 (20.5)
3-8	Q 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-SMe-4-CF ₃	H	
3-9	Q 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-CF ₃	H	
3-10	Q 1 1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	Me	F	104
3-11	Q 1 1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	Me	H	アモルファス
3-12	Q 1 1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	CF ₃	H	85-88
3-13	Q 1 2	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	H	72-73
3-14	Q 1 2	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	OMe	
3-15	Q 1 3	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Br	F	

第3表 (続き)

No	Q	X _n	Y ¹ _{p, q, r} 又はY ²	R ³	物性
3-16	Q 1 3	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Br	H	
3-17	Q 1 3	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Br	OMe	
3-18	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-Br	H	
3-19	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-Br	OMe	
3-20	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-Br	OEt	
3-21	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-Br	H	1.5080 (20.4)
3-22	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-Br	OMe	
3-23	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-Br	OEt	
3-24	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	H	
3-25	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	OMe	
3-26	Q 1 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	OEt	
3-27	Q 1 5	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	H	H	133.5-135
3-28	Q 1 5	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	H	
3-29	Q 1 5	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Br	H	
3-30	Q 1 5	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-I	H	1.5365 (18.4)

第3表 (続き)

No	Q	X n	Y ¹ _{p, q, r} 又はY ²	R ³	物性
3-31	Q 1 5	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-I	OMe	1. 5081 (18. 5)
3-32	Q 1 8	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-Cl	H	104. 5-106
3-33	Q 1 8	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2-Me-5-(2-Cl-Ph)	H	1. 5425 (21. 1)
3-34	Q 2 1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	H	アモルファス
3-35	Q 2 1	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	OMe	1. 4870 (19. 4)
3-36	Q 2 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	H	
3-37	Q 2 4	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3, 5-Me ₂	OMe	

第4表 (R¹=H、R²=CF₃、Z=O、m=0、t=1)

No	Q	X n	Y ¹ _p 又は _r	Y ³	R ³	物性
4-1	Q 8	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-Cl-5-Me	Me	H	160
4-2	Q 8	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	4-Br-5-Me	Me	H	149-150
4-3	Q 1 0	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	H	1. 4848(23. 6)

第4表 (続き)

No	Q	X n	Y ¹ , _p 又は _r	Y ³	R ³	物性
4-4	Q 1 0	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-4-Cl	Me	H	108-109
4-5	Q 1 0	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-4-Br	Me	H	112-113
4-6	Q 1 0	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-t-Bu-4-Cl	Me	H	1.4915(23.9)
4-7	Q 1 0	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me-4-NO ₂	Me	H	1.4971(25.3)
4-8	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Me	F	
4-9	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Me	H	1.5062(18.4)
4-10	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Me	OMe	
4-11	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Me	OEt	
4-12	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Et	F	
4-13	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Et	H	
4-14	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Et	OMe	

第4表 (続き)

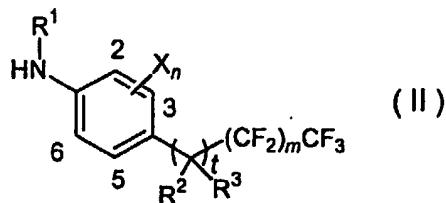
No	Q	X n	Y ¹ , _p 又は _r	Y ³	R ³	物性
4-15	Q 1 6	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	2, 4-Me ₂	Et	OEt	
4-16	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	F	
4-17	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	H	
4-18	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	OMe	
4-19	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Me	Me	OEt	
4-20	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Et	F	
4-21	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Et	H	
4-22	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Et	OMe	
4-23	Q 1 7	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	3-Cl	Et	OEt	

5 第1から表4中、物性がアモルファスで示される化合物の¹H-NMRデータを第5表に示す。

第5表

No.	¹ H-NMR [CDCl ₃ /TMS, δ 値(ppm)]
1-40	8.20(s, 1H), 7.98(s, 1H), 7.90(d, 1H), 7.32-7.25(m, 2H), 4.05(m, 1H), 3.96(s, 3H), 3.20(m, 1H), 1.65-1.40(m, 3H), 1.24(d, 3H), 0.84(m, 6H)
1-72	8.04(d, 1H), 7.87(s, 1H), 7.46-7.39(m, 2H), 3.86(s, 3H), 3.47(s, 3H), 3.03(m, 3H), 2.52(s, 3H), 1.69-1.40(m, 3H), 1.23(d, 3H), 0.84(d, 6H)
1-86	8.01(d, 1H), 7.83(s, 1H), 7.47-7.39(m, 2H), 3.91(s, 3H), 3.47(s, 3H), 3.07(m, 1H), 2.94(m, 1H), 1.67-1.40(m, 3H), 1.30-1.20(m, 6H), 0.84(d, 6H)
1-132	7.98(d, 1H), 7.83(s, 1H), 7.30-7.21(m, 2H), 4.04(m, 1H), 3.87(s, 3H), 3.10-2.80(m, 3H), 1.63-1.40(m, 3H), 1.33-1.18(m, 6H), 0.84(d, 6H)
1-148	8.13(d, 1H), 7.50-7.40(m, 2H), 7.33(s, 1H), 3.77(s, 3H), 2.82(m, 1H), 2.54(s, 3H), 2.51(s, 3H), 1.72-1.52(m, 2H), 1.52-1.39(m, 1H), 1.27(d, 3H), 1.21-1.10(m, 1H), 1.10-0.91(m, 1H), 0.82(d, 6H)
3-5	8.32(s, 1H), 8.20(d, 1H), 8.01(d, 1H), 7.35-7.20(m, 3H), 4.06(m, 1H), 3.05(m, 1H), 2.61(s, 3H), 1.60-1.40(m, 3H), 1.22(d, 3H), 0.84(d, 6H)
3-34	7.85(d, 1H), 7.31-7.20(m, 3H), 4.06(m, 1H), 2.92(m, 1H), 2.67(s, 3H), 2.51(s, 3H), 1.60-1.40(m, 3H), 1.22(t, 3H), 0.85(m, 6H)

一般式 (II)

第6表 (R¹=H, t=1)

No	X n	m	R ²	R ³	¹ H-NMR [CDCl ₃ /TMS, δ 值(ppm)]
5-1	2- <i>n</i> -Pr	0	CF ₃	H	7.12-7.02(m, 2H), 6.69(d, 1H), 4.0-3.7(m, 3H), 2.52(q, 2H), 1.27(t, 3H)
5-2	2- <i>t</i> -Bu	0	CF ₃	H	7.17(s, 1H), 7.06(d, 1H), 6.64(d, 1H), 4.1-3.9(br, 2H), 3.91(m, 1H), 1.41(s, 9H)
5-3	2-Ph	0	CF ₃	H	7.52-7.32(m, 5H), 7.19-7.10(m, 2H), 6.77(d, 1H), 4.08-3.85(m, 3H)
5-4	2-CH(Me) CHMe ₂	0	CF ₃	H	7.08-7.01(m, 2H), 6.71(s, 1H), 3.91(m, 1H), 2.50(m, 1H), 1.87(m, 1H), 1.21(d, 3H), 0.92(d, 3H), 0.87(d, 3H)
5-5	2-CH(Me) CHMe ₂ -6-Et	0	CF ₃	H	6.96(d, 2H), 3.92(m, 1H), 3.85-3.70(br, 2H), 2.65(m, 1H), 2.53(dd, 2H), 1.80-1.50(m, 2H), 1.23(d, 3H), 0.90(t, 3H)
5-6	2-(CH ₂) ₄ -3	0	CF ₃	H	7.24(d, 1H), 6.60(d, 1H), 4.41(m, 1H), 3.76(br, 2H), 2.70(br, 2H), 2.47(br, 2H), 1.84(m, 4H)

第6表 (続き)

No	X n	m	R ²	R ³	¹ H-NMR [CDCl ₃ /TMS, δ 値(ppm)]
5-7	2-CH=CH-CH =CH-3	O	CF ₃	H	7. 91-7. 84 (m, 2H), 7. 68-7. 47 (m, 3H), 6. 82 (d, 1H), 4. 96 (m, 1H), 4. 40-4. 20 (br, 2H)
5-8	2-CH(Me) CH ₂ CH ₃	O	CF ₃	H	7. 06-6. 98 (m, 2H), 6. 67 (d, 1H), 3. 91 (m, 1H), 3. 85-3. 70 (br, 2H), 2. 62 (m, 1H), 1. 78-1. 50 (m, 2H), 1. 22 (d, 3H), 0. 89 (t, 3H)
5-9	2-CH(Me) CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CF ₃	H	7. 08-7. 00 (m, 2H), 6. 67 (d, 1H), 3. 91 (m, 1H), 3. 82-3. 70 (br, 2H), 2. 71 (m, 1H), 1. 70-1. 50 (m, 2H), 1. 40-1. 20 (m, 5H), 0. 90 (t, 3H)
5-10	2-CH(Me) CH ₂ CH ₂ CH ₃	O	CF ₃	OMe	7. 24 (s, 1H), 7. 16 (d, 1H), 6. 70 (d, 1H), 4. 00-3. 82 (br, 2H), 3. 43 (s, 3H), 2. 73 (m, 1H), 1. 70-1. 45 (m, 2H), 1. 40-1. 20 (m, 5H), 0. 90 (t, 3H)
5-11	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	O	CF ₃	H	7. 10-7. 00 (m, 2H), 6. 69 (s, 1H), 3. 91 (m, 1H), 2. 80 (m, 1H), 1. 65-1. 50 (m, 2H), 1. 43-1. 32 (m, 1H), 1. 21 (d, 3H), 0. 89 (t, 6H)
5-12	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	O	CF ₃	OH	7. 39 (s, 1H), 7. 30 (d, 1H), 6. 68 (d, 1H), 3. 90-3. 60 (br, 2H), 2. 79 (m, 1H), 1. 61-1. 50 (m, 1H), 1. 45-1. 35 (m, 1H), 1. 21 (d, 3H), 0. 89 (q, 6H)
5-13	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	O	CF ₃	OMe	7. 26 (s, 1H), 7. 15 (d, 1H), 6. 70 (d, 1H), 4. 00-3. 65 (br, 2H), 3. 43 (s, 1H), 2. 79 (m, 1H), 1. 56 (m, 2H), 1. 37 (m, 1H), 1. 20 (d, 3H), 0. 91 (t, 6H)
5-14	2-CH(Me)CH ₂ CHMe ₂	O	CF ₃	OEt	7. 26 (s, 1H), 7. 16 (d, 1H), 6. 69 (d, 1H), 3. 98-3. 67 (br, 2H), 3. 59 (q, 2H), 2. 80 (m, 1H), 1. 56 (m, 2H), 1. 38 (m, 1H), 1. 30 (t, 3H), 1. 20 (d, 3H), 0. 89 (t, 6H)

第6表 (続き)

No	X n	m	R ²	R ³	¹ H-NMR [CDCl ₃ /TMS, δ 値(ppm)]
5-15	2-CH(Me) CH ₂ CH ₂ CH Me ₂	0	CF ₃	H	7.08-7.00(m, 2H), 6.68(d, 1H), 3.92(m, 1H), 3.99-3.70(br, 2H), 2.65(m, 1H), 1.78-1.42 (m, 4H), 1.30-1.10(m, 5H), 0.86(d, 6H)
5-16	2-CH(Me) CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	0	CF ₃	H	7.26(s, 1H), 7.20(d, 1H), 6.71(d, 1H), 3.95-3.78(br, 2H), 2.69(m, 1H), 1.72-1.42 (m, 2H), 1.40-1.18(m, 7H), 0.88(t, 3H)
5-17	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	0	H	H	6.98(s, 1H), 6.92(d, 1H), 6.65(d, 1H), 3.85-3.60(br, 2H), 3.24(dd, 2H), 2.79(m, 1H), 1.65-1.48(m, 2H), 1.45-1.30(m, 1H), 1.19(d, 3H), 0.90(t, 6H)
5-18	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	2	H	H	6.97(s, 1H), 6.90(d, 1H), 6.65(d, 1H), 3.82-3.40(br, 2H), 3.23(t, 2H), 2.79(m, 1H), 1.70-1.50(m, 2H), 1.39(m, 1H), 1.20(d, 3H), 0.90(t, 6H)
5-19	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	4	H	H	6.97(s, 1H), 6.92(d, 1H), 6.65(d, 1H), 4.00-3.70(br, 2H), 3.24(t, 2H), 2.79(m, 1H), 1.68-1.48(m, 2H), 1.45-1.30 (m, 1H), 1.22(d, 3H), 0.89(m, 6H)
5-20	2-CH(Me) CH ₂ CHMe ₂	6	H	H	6.97(s, 1H), 6.90(d, 1H), 6.65(d, 1H), 3.24(t, 2H), 2.79(m, 1H), 1.67-1.45(m, 2H), 1.42-1.30(m, 1H), 1.22(d, 3H), 0.90(t, 6H)

以下に本発明の代表的な実施例、製剤例及び試験例を例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

5 実施例 1-1. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-[2, 2, 2-トリフルオロロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン(化合物No. 5-11)の製造

水素化リチウムアルミニウム(2 g, 52.7 mmol)をテトラヒドロフラン(60 ml)に懸濁させ、2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-[1, 2, 2,

10 2-テトラフルオロロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン(14 g,

40. 5 mmol) を滴下し、還流温度で3時間攪拌した。氷冷下、反応液に水を少量ずつ加え、その後10分間攪拌した。硫酸マグネシウムを加え、その後10分間攪拌した。反応液をセライトろ過し、ろ液を減圧濃縮することにより、目的物13gを得た。

5 収率98%

実施例1-2. N-(2-(1,3-ジメチルブチル)-4-[2,2,2-トリフルオロー-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル)-5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-4-カルボン酸アミド(化合物No. 1-103)の製造

10 5-クロロ-1-メチル-3-トリフルオロメチルピラゾール-4-カルボン酸(230mg、1mmol)をチオニルクロリド(2ml)に溶解し、還流温度で2時間攪拌した。減圧濃縮後、得られた酸クロリドを2-(1,3-ジメチルブチル)-4-[2,2,2-トリフルオロー-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン(330mg、1mmol)及びトリエチルアミン(150mg、1.5mmol)をテトラヒドロフラン(10ml)に溶解した溶液に氷冷下に加え、室温で2時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈後、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=3:1)にて分離精製することにより目的物233mgを得た。

20 物性:融点102-104°C 収率43%

実施例2-1. 2-(1,3-ジメチルブチル)-4-[1-メトキシ-2,2-トリフルオロー-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン(化合物No. 5-13)の製造

ナトリウム(533mg, 23mmol)をメタノール(40ml)に溶解した後、2-(1,3-ジメチルブチル)-4-[1,2,2,2-テトラフルオロー-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン(2g, 5.8mmol)を加え、還流温度で3時間攪拌した。反応液を減圧濃縮した後、残渣を酢酸エチルで希釈し、水で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=

6 : 1) にて分離精製することにより目的物 1. 8 g を得た。

収率 87%

実施例 2-2. N-[2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-[1-メトキシ-2, 2-トリフルオロー-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル]-1, 3, 5-トリメチルピラゾール-4-カルボン酸アミド (化合物 No. 1-108) の製造

1, 3, 5-トリメチルピラゾール-4-カルボン酸 (154 mg, 1 mmol) をチオニルクロリド (5 ml) に溶解し、2時間加熱還流した。反応液を減圧濃縮後、得られた酸クロリドを氷冷下、2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-[1-メトキシ-2, 2-トリフルオロー-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン (345 mg, 1 mmol) 及びトリエチルアミン (150 mg, 1.5 mmol) をテトラヒドロフラン (10 ml) に溶解した溶液に加え、その後2時間加熱還流した。反応液を酢酸エチルで希釈後、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (ヘキサン:酢酸エチル = 1 : 2) にて分離精製することにより目的物 200 mg を得た。

物性：融点 94-96°C 収率 41%

実施例 3-1. 2-(1-ヒドロキシ-1, 4-ジメチルペンチル)アニリンの製造

ジエチルエーテル (15 ml) にマグネシウム (960 mg, 40 mmol) を加え、触媒量のヨウ素を加えた後、イソアミルブロミド (6.04 g, 40 mmol) を還流下徐々に加え、還流温度で30分間攪拌後、室温で30分間攪拌した。この溶液に、氷冷下に2-アミノアセトフェノン (1.8 g, 13.3 mmol) を加え、室温で3時間攪拌した。塩化アンモニウムを加えた後、酢酸エチルで希釈し、水洗した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、2-(1-ヒドロキシ-1, 4-ジメチルペンチル)アニリン 2.7 g を得た。

物性 $^1\text{H-NMR}$ [CDCl₃/TMS, δ 値 (ppm)]

7.10-7.00 (m, 2H), 6.72-6.60 (m, 2H), 4.00-3.70 (br, 2H), 2.03 (m, 2H), 1.61 (s, 3H), 1.50 (m, 2H), 1.20-1.00 (m, 1H), 0.90-0.83 (m, 6H)

収率 9 9 %

実施例 3-2. 2-(1, 4-ジメチルペニチル) アニリンの製造

実施例 3-1 で得られた 2-(1-ヒドロキシ-1, 4-ジメチルペニチル) アニリン 2. 7 g (13. 1 mmol) をトルエンに希釈し、パラトルエンスルホン酸一水和物 (225 mg) を加え、ディーンスターク管で還流下 3 時間かけて脱水した。反応液を酢酸エチルで希釈後、重曹水、飽和食塩水で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残渣を、エタノールに溶解し、5%パラジウムカーボン (100 mg) を加え、水素雰囲気下室温で 12 時間攪拌した。反応液をセライトろ過し、残渣を減圧濃縮し、2-(1, 4-ジメチルペニチル) アニリン 2. 2 g を得た。

物性: $^1\text{H-NMR}$ [CDCl₃/TMS, δ 値 (ppm)]

7.10 (dd, 2H), 7.02 (dt, 1H), 6.79 (dt, 1H), 6.69 (dd, 1H), 3.67 (bs, 2H), 2.68 (m, 1H),
1.80-1.42 (m, 4H), 1.30-1.10 (m, 5H), 0.87 (d, 6H)

収率 8 7 %

15 実施例 3-3. 2-(1, 4-ジメチルペニチル)-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル] アニリンの製造

実施例 3-2 で得られた 2-(1, 4-ジメチルペニチル) アニリン (1. 8 g, 9. 4 mmol) を t-ブチルメチルエーテル-水の 1:1 の溶液 (50 ml) に溶解し、1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチルヨージド (2. 78 g, 9. 4 mmol)、テトラ-n-ブチルアンモニウム硫酸水素塩 (318 mg, 0. 94 mmol)、炭酸水素ナトリウム (795 mg, 9. 4 mmol)、亜ジチオン酸ナトリウム (1. 63 g, 9. 4 mmol) を順次加え、室温で 12 時間攪拌した。反応液をヘキサンで希釈し、3 N-塩酸で 2 度洗浄後、重曹水、飽和食塩水で洗浄した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、目的物 3. 28 g を得た。

物性: $^1\text{H-NMR}$ [CDCl₃/TMS, δ 値 (ppm)]

7.26 (s, 1H), 7.21 (d, 1H), 6.72 (d, 1H), 4.05-3.80 (br, 2H), 2.67 (m, 1H), 1.78-1.40 (m, 4H), 1.30-1.00 (m, 5H), 0.85 (d, 6H)

収率 9 7 %

実施例3-4. 2-(1, 4-ジメチルペンチル)-4-[2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン(化合物No. 5-15)の製造

2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-5-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリンのかわりに2-(1, 4-ジメチルペンチル)-4-[1, 2, 2, 2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリンを用いた以外は実施例1-1と同様にして、4時間反応を行うことにより目的物を得た。

収率82%

10 実施例3-5. N-(2-(1, 4-ジメチルペンチル)-4-[2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]フェニル)-5-クロロ-1, 3-ジメチルピラゾール-4-カルボン酸アミド(化合物No. 1-146)の製造

5-クロロ-1, 3-ジメチルピラゾール-4-カルボン酸(349mg, 2.15mmol)をチオニルクロリド(10ml)に溶解し、還流温度で2時間攪拌した。減圧濃縮後、得られた酸クロリドを2-(1, 4-ジメチルペンチル)-4-[2, 2, 2-トリフルオロ-1-(トリフルオロメチル)エチル]アニリン(682mg, 2mmol)及びトリエチルアミン(300mg, 3mmol)をテトラヒドロフラン(20ml)に溶解した溶液に氷冷下に加え、還流温度で2時間攪拌した。反応液を酢酸エチルで希釈後、水洗した。有機層を無水硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=2:3)にて分離精製することにより目的物200mgを得た。

物性:屈折率1.4905(20.4°C) 収率41%

25 実施例4-1. 4-ヨード-2-(1, 3-ジメチルブチル)アニリンの製造
ヨウ素2.53g(10mmol)をメタノールに溶解し、2-(1, 3-ジメチルブチル)アニリンを(1.77g, 10mmol)を氷冷下加えたのち、炭酸水素ナトリウム(1.26g, 15mmol)の水溶液を加え0°Cで4時間攪拌した。反応液にチオ硫酸ナトリウムを加えた後、減圧濃縮し、酢酸エチルで

希釈後、水洗した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=10:1）にて分離精製し、目的物2.71gを得た。

収率89%

5 実施例4-2. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ペンタフルオロエチルアニリンの製造

4-ヨード-2-(1, 3-ジメチルブチル)アニリン(1.35g, 4.45mmol)、銅粉(0.85g, 13.4mmol)、ペンタフルオロエチルヨージド(1.42g, 5.77mmol)をジメチルスルホキシド

10 (10ml)に加え、130°Cで4時間攪拌した。セライトろ過後、ろ液を酢酸エチルで希釈し、4回水洗した。有機層を硫酸マグネシウムで乾燥後、減圧濃縮し目的物1.24gを得た。

物性: $^1\text{H-NMR}$ [CDCl₃/TMS, δ値(ppm)]

7.26(s, 1H), 7.20(d, 1H), 6.70(d, 1H), 4.00-3.85(br, 2H), 3.00(m, 1H),

15 1.68-1.50(m, 2H), 1.48-1.30(m, 1H), 1.22(t, 3H), 0.94(m, 6H)

収率95%

実施例4-3. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-(2, 2, 2-トリフルオロエチル)アニリン(化合物No. 5-17)の製造

水素化リチウムアルミニウム(1.62g, 4.26mmol)をテトラヒドロフラン(20ml)に溶解し、2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ペンタフルオロエチルアニリン(974mg, 3.3mmol)を滴下し、還流温度で3時間攪拌した。氷冷下、反応液に水を少量ずつ加え、その後10分間攪拌した。硫酸マグネシウムを加え、その後10分間攪拌した。反応液をセライトろ過し、ろ液を減圧濃縮し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（ヘキサン：酢酸エチル=9:1）にて分離精製し目的物260mgを得た。

収率30%

実施例5-1. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ノナフルオロブチルアニリンの製造

ペンタフルオロエチルヨージドのかわりにノナフルオロブチルヨージドを用い

た以外は実施例4-2と同様にして4時間反応を行うことにより目的物を得た。

物性： $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 値(ppm)]

7.25(s, 1H), 7.20(d, 1H), 6.71(d, 1H), 4.02-3.85(m, 2H), 2.79(m, 1H),
1.68-1.50(m, 2H), 1.50-1.35(m, 1H), 1.22(d, 3H), 0.90(t, 6H)

5 収率90%

実施例5-2. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-(2, 2, 3, 3, 4, 4, 4-ヘプタフルオロヘキシル)アニリン(化合物No. 5-18)の製造
2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ペンタフルオロエチルアニリンのかわりに2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ノナフルオロブチルアニリンを用い

10 た以外は実施例4-3と同様にして3時間攪拌することにより目的物を得た。

収率92%

実施例6-1. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-トリデカフルオロヘキシルアニリンの製造

15 ペンタフルオロエチルヨージドのかわりにトリデカフルオロヘキシルヨージドを用いた以外は実施例4-2と同様にして4時間反応を行うことにより目的物を得た。

物性： $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 値(ppm)]

7.25(s, 1H), 7.20(d, 1H), 6.71(d, 1H), 4.05-3.87(m, 2H), 2.79(m, 1H),
1.68-1.50(m, 2H), 1.48-1.30(m, 1H), 1.22(d, 3H), 0.90(t, 6H)

20 収率87%

実施例6-2. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-(2, 2, 3, 3, 4, 4, 5, 5, 6, 6, 6-ウンデカフルオロヘキシル)アニリン(化合物No. 5-19)の製造

25 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ペンタフルオロエチルアニリンのかわりに2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-トリデカフルオロヘキシルアニリンを用いた以外は実施例4-3と同様にして3時間攪拌することにより目的物を得た。

収率85%

実施例7-1. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ヘプタデカフルオロオク

チルアニリンの製造

ペンタフルオロエチルヨージドのかわりにヘプタデカフルオロオクチルヨージドを用いた以外は実施例4-2と同様にして4時間反応を行うことにより目的物を得た。

5 物性： $^1\text{H-NMR}$ [CDCl_3/TMS , δ 値(ppm)]

7.24(s, 1H), 7.19(d, 1H), 6.70(d, 1H), 4.05-3.85(br, 2H), 2.78(m, 1H),
1.67-1.50(m, 3H), 1.50-1.32(m, 1H), 1.21(d, 3H), 0.89(t, 6H)

収率40%

実施例7-2. 2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-(2, 2, 3, 3, 4, 10 4, 5, 5, 6, 6, 6-ペンタデカフルオロオクチル)アニリン(化合物No. 5-20)の製造

2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ペンタフルオロエチルアニリンのかわりに2-(1, 3-ジメチルブチル)-4-ヘプタデカフルオロオクチルアニリンを用いた以外は実施例4-3と同様にして3時間攪拌することにより目的物を得た。

15 収率58%

本発明の一般式(I)で表される置換アニリド誘導体を有効成分として含有する農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤、又は殺ダニ剤は水稻、果樹、野菜、その他の作物及び花卉用を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に適しており、例えばリンゴコカクモンハマキ(Adoxophyes orana fasciata)、チャノコカクモンハマキ(Adoxophyes sp.)、リンゴコシンクイ(Grapholita inopinata)、ナシヒメシンクイ(Grapholita molesta)、マメシンクイガ(Leguminivora glycinvorella)、クワハマキ(Olethreutes mori)、チャノホソガ(Caloptilia thevivora)、リンゴホソガ(Caloptilia zachrysa)、キンモンホソガ(Phyllonorycter ringoniella)、ナシホソガ(Spulerrina astaurota)、モンシロチョウ(Piers rapae crucivora)、オオタバコガ類(Heliothis sp.)、コドリンガ(Laspeyresia pomonella)、コナガ(Plutella xylostella)、リンゴヒメシンクイ(Argyresthia conjugella)、モモシンクイガ(Carposina nipponensis)、ニカメイガ(Chilo suppressalis)、コブノメイガ(Cnaphalocrocis

medinalis)、チャマダラメイガ(Ephestia elutella)、クワノメイガ(Glyphodes pyloalis)、サンカメイガ(Scirpophaga incertulas)、イチモンジセセリ(Parnara guttata)、アワヨトウ(Pseudaletia separata)、イネヨトウ(Sesamia inferens)、ハスモンヨトウ(Spodoptera litura)、シロイチモジヨトウ(Spodoptera exigua)等の鱗翅目害虫、フタテンヨコバイ(Macrosteles fascifrons)、ツマグロヨコバイ(Nephrotettix cincticeps)、トビイロウンカ(Nilaparvata lugens)、セジロウンカ(Sogatella furcifera)、ミカンキジラミ(Diaphorina citri)、ブドウコナジラミ(Aleurolobus taonabae)、タバココナジラミ(Bemisia tabaci)、オンシツコナジラミ(Trialeurodes vaporariorum)、ニセダイコンアブラムシ(Lipaphis erysimi)、モモアカアブラムシ(Myzus persicae)、ツノロウムシ(Ceroplastes ceriferus)、ミカンワタカイガラムシ(Pulvinaria aurantii)、ミカンマルカイガラムシ(Pseudaonidia duplex)、ナシマルカイガラムシ(Comstockaspis perniciosa)、ヤノネカイガラムシ(Unaspis yanonenensis)等の半翅目害虫、ネグサレセンチュウ(Pratylenchus sp.)、ヒメコガネ(Anomala rufocuprea)、マメコガネ(Popilla japonica)、タバコシバンムシ(Lasioderma serricorne)、ヒラタキクイムシ(Lyctus brunneus)、ニジュウヤホシテントウ(Epilachna vigintiotpunctata)、アズキゾウムシ(Callosobruchus chinensis)、ヤサイゾウムシ(Listroderes costirostris)、コクゾウムシ(Sitophilus zeamais)、ワタミゾウムシ(Anthonomus grandis)、イネミズゾウムシ(Lissorhoptrus oryzophilus)、ウリハムシ(Aulacophora femoralis)、イネドロオイムシ(Oulema oryzae)、キスジノミハムシ(Phyllotreta striolata)、マツノキクイムシ(Tomicus piniperda)、コロラドポテトビートル(Leptinotarsa decemlineata)、メキシカンビーンビートル(Epilachna varivestis)、コーンルートワーム類(Diabrotica sp.)等の甲虫目害虫、ウリミバエ(Dacus(Zeugodacus)cucurbitae)、ミカンコミバエ(Dacus(Bactrocera)dorsalis)、イネハモグリバエ(Agromyza oryzae)、タマネギバエ(Delia antiqua)、タネバエ(Dalia platura)、ダイズサヤタマバエ(Asphondylis sp.)、イエバエ(Musca domestica)、アカイエカ(Culex pipiens pipiens)等の双翅目害虫、ミナミネグサレセンチュウ(Pratylenchus coffeae)、

ジャガイモシストセンチュウ (*Glabodera rostchiensis*)、ネコブセンチュウ (*Meloidogyne* sp.)、ミカンネセンチュウ (*Tylenchulus semipenetrans*)、ニセネグサレセンチュウ (*Aphelenchus avenae*)、ハガレセンチュウ (*Aphelenchoides ritzemabosi*) 等のハリセンチュウ目害虫、ミカンハダニ (*Panonychus citri*)、リ

5 ンゴハダニ (*Panonychus ulmi*)、ニセナミハダニ (*Tetranychus cinnabarinus*)、カンザワハダニ (*Tetranychus kanzawai* Kishida)、ナミハダニ (*Tetranychus urticae* Koch)、チャノナガサビダニ (*Acaphylla theae*)、ミカンサビハダニ (*Aculops pelekassi*)、チャノサビダニ (*Calacarus carinatus*)、ナシサビダニ (*Epitrimerus pyri*) 等のダニ目害虫に対して強い殺虫効果を有するものである。

10 又、本発明の一般式(I) で表される置換アニリド誘導体を有効成分とする農園芸用薬剤は農園芸用殺菌剤としても有用であり、例えば稲いもち病 (*Pyricularia oryzae*)、稲紋枯病 (*Rhizoctonia solani*)、稻胡麻葉枯病 (*Cochiobolus miyabeanus*)、大麦及び小麦のうどんこ病 (*Erysiphe graminis*) の如き種々の宿主植物についてのうどんこ病、エンバクの冠さび病 (*Puccinia coronata*) 及び他

15 15 の植物のさび病、トマトの疫病 (*Phytophthora infestans*) 及び他の植物の疫病、キュウリのべと病 (*Pseudoperonospora cubensis*)、ブドウのべと病 (*Plasmopara viticola*) 等の種々植物のべと病、リンゴ黒星病 (*Venturia inaequalis*)、リンゴ斑点落葉病 (*Alternaria mali*)、ナシ黒斑病 (*Alternaria kikuchiana*)、カンキツ黒点病 (*Diaporthe citri*)、シードモナス種、例えばキュウリ斑点細菌病

20 20 (*Pseudomonas syringae* pv. *lachrymans*)、トマト青枯病 (*Pseudomonas solanacearum*)、キサントモナス種、例えばキャベツ黒腐病 (*Xanthomonas campestris*)、稻白葉枯病 (*Xanthomonas oryzae*)、カンキツかいよう病 (*Xanthomonas citri*)、エルウィニア種、例えばキャベツ軟腐病 (*Erwinia carotovora*) 等の細菌病、タバコモザイク病 (*Tabacco mosaic virus*) 等の病害に

25 25 対して極めて高い防除効果を示すものである。

本発明の一般式(I) で表される置換アニリド誘導体を有効成分とする農園芸用薬剤、特に農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で水

田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壤に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。

本発明の農園芸用薬剤は、農薬製剤上の常法に従い使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

5 即ち、一般式(I)で表される置換アニリド誘導体はこれらを適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させて適宜の剤型、例えば懸濁剤、乳剤、液剤、水和剤、顆粒水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤して使用すれば良い。

本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、

10 固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、纖維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、粉碎合成樹脂等の合成重合体、粘土類（例えばカオリン、ベントナイト、酸性白土等）、タルク類（例えばタルク、ピロフィライト等）、シリカ類（例えば珪藻土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン（含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成15 高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。）、活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉碎物、フライアッシュ、砂、炭酸カルシウム、磷酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、ポリエチレン、ポリプロピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、硫安、磷安、硝安、尿素、塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上20 上の混合物の形で使用される。

液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させうこととなるものから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類（例25 えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコール等）、ケトン類（例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサン等）、エーテル類（例えばエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等）、脂肪族炭化水素類（例えばケロシン、鉱油等）、芳香族炭化水素類（例

えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン等)、ハロゲン化炭化水素類(例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素、塩素化ベンゼン等)、エステル類(例えば酢酸エチル、ジイソブチルフタレート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等)、アミド類(例えばジメチルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等)、ニトリル類(例えばアセトニトリル等)、ジメチルスルホキシド類等を挙げることができる。

他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これらの補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び/又は湿润の目的のために界面活性剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオキシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩、ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エス

テル等の界面活性剤を例示することができる。

又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び/又は結合の目的のために、次に例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例えばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。

懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸塩等の補助剤を使用することもできる。

消泡剤としては、例えばシリコーン油等の補助剤を使用することもできる。

防腐剤としては、1, 2-ベンズイソチアゾリン-3-オン、パラクロロメタキシレノール、パラオキシ安息香酸ブチル等も添加することが出来る。

更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、BHT等の酸化防止剤、紫外線吸収剤等その他の添加剤も加えることが可能である。

有効成分化合物の配合割合は必要に応じて加減することができ、農園芸用殺虫剤100重量部中、0.01～90重量部の範囲から適宜選択して使用すれば良く、例えば粉剤又は粒剤とする場合は0.01～50重量%、又乳剤又は水和剤とする場合も同様0.01～50重量%が適当である。

本発明の農園芸用薬剤は各種病害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害虫防除に有効な量を当該病害虫の発生が予測される作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用すれば良い。

本発明の農園芸用薬剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001g～10kg、好ましくは0.01g～1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。

本発明の農園芸用薬剤は、更に防除対象病害虫、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、又、使用場面に応じて除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することも可能である。

かかる目的で使用する他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤としては、例えばエチオン、トリクロルホン、メタミドホス、アセフェート、ジクロルボス、メビンホス、モノクロトホス、マラチオン、ジメトエート、ホルモチオン、メカルバム、バミドチオン、チオメトン、ジスルホトン、オキシデプロホス、ナレッド、メチルパラチオン、フェニトロチオン、シアノホス、プロパホス、フェンチオン、プロチオホス、プロフェノホス、イソフェンホス、テメホス、フェントエート、ジメチルビンホス、クロルフェビンホス、テトラクロルビンホス、ホキシム、イソキサチオン、ピラクロホス、メチダチオン、クロロピリホス、クロルピリホス・メチル、ピリダフェンチオン、ダイアジノン、ピリミホスメチル、ホサロン、ホスマット、ジオキサベンゾホス、キナルホス、テルブホス、エトプロホス、カ

ズサホス、メスルフェンホス、DPS (NK-0795)、ホスホカルブ、フェナミホス、イソアミドホス、ホスチアゼート、イサゾホス、エナプロホス、フェンチオン、ホスチエタン、ジクロフェンチオン、チオナジン、スルプロホス、フェンスルフォチオン、ジアミダホス、ピレトリン、アレスリン、プラレトリン、
 5 レスマトリノ、ペルメトリノ、テフルトリノ、ビフェントリノ、フェンプロパトリン、シペルメトリノ、アルファシペルメトリノ、シハロトリノ、ラムダ・シハロトリノ、デルタメトリノ、アクリナトリノ、フェンパレレート、エスフェンバレート、フルシトリネート、フルバリネート、シクロプロトリノ、エトフェンプロックス、ハルフェンプロックス、シラフルオフェン、フルシトリネート、フルバリネート、メソミル、オキサミル、チオジカルブ、アルジカルブ、アラニカルブ、カルタップ、メトルカルブ、キシリカルブ、プロポキスル、フェノキシカルブ、フェノブカルブ、エチオフェンカルブ、フェノチオカルブ、ビフェナゼート、BPMC、カルバリル、ピリミカーブ、カルボフラン、カルボスルファン、フラチオカルブ、ベンフラカルブ、アルドキシカルブ、ジアフェンチウロン、ジ
 15 フルベンズロン、テフルベンズロン、ヘキサフルムロン、ノバルロン、ルフェヌロン、フルフェノクスロン、クロルフルアズロン、酸化フェンプタスズ、水酸化トリシクロヘキシルスズ、オレイン酸ナトリウム、オレイン酸カリウム、メトブレン、ハイドロブレン、ビナパクリル、アミトラズ、ジコホル、ケルセン、クロルベンジレート、フェニソプロモレート、テトラジホン、ベンスルタップ、ベン
 20 ソメート、テブフェノジド、メトキシフェノジド、クロマフェノジド、プロパルギット、アセキノシル、エンドスルファン、ジオフェノラン、クロルフェナピル、フェンピロキシメート、トルフェンピラド、フィプロニル、テブフェンピラド、トリアザメート、エトキサゾール、ヘキシチアゾクス、硫酸ニコチン、ニテンピラム、アセタミpriド、チアクロpriド、イミダクロpriド、チアメトキサム、
 25 クロチアニジン、ニジノテフラン、フルアジナム、ピリプロキシフェン、ヒドロメチルノン、ピリミジフェン、ピリダベン、シロマジン、T P I C (トリプロピルイソシアヌレート)、ピメトロジン、クロフェンテジン、ブプロフェジン、チオシクラム、フェナザキン、キノメチオネート、インドキサカルブ、ポリナクチン複合体、ミルペメクチン、アバメクチン、エマメクチン・ベンゾエート、スピ

ノサッド、BT (バチルス・チューリングンシス)、アザディラクチン、ロテノン、ヒドロキシプロピルデンプン、塩酸レバミゾール、メタム・ナトリウム、酒石酸モランテル、ダゾメット、トリクラミド、バストリア、モナクロスポリウム・フィマトパガム等の農園芸殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤を例示することができ、

5 同様の目的で使用する農園芸用殺菌剤としては、例えば硫黄、石灰硫黄合剤、塩基性硫酸銅、イプロベンホス、エディフェンホス、トルクロホス・メチル、チラム、ポリカーバメイト、ジネブ、マンゼブ、マンコゼブ、プロピネブ、チオファネート、チオファネートメチル、ベノミル、イミノクタジン酢酸塩、イミノクタジンアルベシル酸塩、メプロニル、フルトラニル、ペンシクロン、フラメトピル、

10 チフルザミド、メタラキシル、オキサジキシル、カルプロパミド、ジクロフルアニド、フルスルファミド、クロロタロニル、クレソキシム・メチル、フェノキサニル (NNF-9425)、ヒメキサゾール、エクロメゾール、フルオルイミド、プロシミドン、ピンクロゾリン、イプロジオン、トリアジメホン、トリフルミゾール、ピテルタノール、トリフルミゾール、イプロコナゾール、フルコナゾール、

15 プロピコナゾール、ジフェノコナゾール、ミクロブタニル、テトラコナゾール、ヘキサコナゾール、テブコナゾール、イミベンコナゾール、プロクロラズ、ペフラゾエート、シプロコナゾール、イソプロチオラン、フェナリモル、ピリメタニル、メパニピリム、ピリフェノックス、フルアジナム、トリホリン、ジクロメジン、アゾキシストロビン、チアジアジン、キャプタン、プロベナゾール、アシベ

20 シゾフラル-S-メチル (CGA-245704)、フサライド、トリシクラゾール、ピロキロン、キノメチオネット、オキソリニック酸、ジチアノン、カスガマイシン、バリダマイシン、ポリオキシン、ブラストサイジン、ストレプトマイシン等の農園芸用殺菌剤を例示することができ、同様に除草剤としては、例えばグリホサート、スルホセート、グルホシネット、ピアラホス、ブタミホス、エス

25 プロカルブ、プロスルホカルブ、ベンチオカーブ、ピリブチカルブ、アシュラム、リニュロン、ダイムロン、ベンスルフロン-メチル、シクロスルファムロン、シノスルフロン、ピラゾスルフロンエチル、アジムスルフロン、イマゾスルフロン、テニルクロール、アラクロール、プレチラクロール、クロメプロップ、エトベンザニド、メフェナセット、ペンディメタリン、ビフェノックス、アシフルオフェ

ン、ラクトフェン、シハロホップープチル、アイオキシニル、プロモブチド、アロキシジム、セトキシジム、ナプロパミド、インダノファン、ピラゾレート、ベンゾフェナップ、ピラフルフェン・エチル、イマザピル、スルフェントラゾン、カフェンストロール、ベントキサゾン、オキサゾアゾン、パラコート、ジクワット、ピリミノバック、シマジン、アトラジン、ジメタメトリン、トリアジフラム、ベンフレセート、フルチアセット・メチル、キザロホップ・エチル、ベンタゾン、過酸化カルシウム等の除草剤を例示することができる。

又、生物農薬として、例えば核多角体ウイルス (Nuclear polyhedrosis virus, NPV) 、顆粒病ウイルス (Granulosis virus, GV) 、細胞質多角体病ウイルス (Cytoplasmic polyhedrosis virus, CPV) 、昆虫ポックスウイルス (Entomopox virus, EPV) 等のウイルス製剤、モノクロスポリウム・フィマトパガム (Monacrosporium phymatophagum) 、スタイナーネマ・カーポカプサエ (Steinernema carpocapsae) 、スタイナーネマ・クシダエ (Steinernema kushidai) 、パストーリア・ペネトランス (Pasteuria penetrans) 等の殺虫又は殺線虫剤として利用される微生物農薬、トリコデルマ・リグノラン (Trichoderma lignorum) 、アグロバクテリウム・ラジオバクター (Agrobacterium radiobacter) 、非病原性エルビニア・カロトボーラ (Erwinia carotovora) 、バチルス・ズブチリス (Bacillus subtilis) 等の殺菌剤として使用される微生物農薬、ザントモナス・キャンペストリス (Xanthomonas campestris) 等の除草剤として利用される生物農薬などと混合して使用することにより、同様の効果が期待できる。

更に、生物農薬として例えばオンシツツヤコバチ (Encarsia formosa) 、コレマンアブラバチ (Aphidius colemani) 、ショクガタマバエ (Aphidoletes aphidimyza) 、イサエアヒメコバチ (Diglyphus isaea) 、ハモグリコマユバチ (Dacnusa sibirica) 、チリカブリダニ (Phytoseiulus persimilis) 、ククメリスカブリダニ (Amblyseius cucumeris) 、ナミヒメハナカメムシ (Orius sauteri) 等の天敵生物、ボーベリア・ブロンニアティ (Beauveria brongniartii) 等の微生物農薬、(Z)-10-テトラデセニル=アセタート、(E, Z)-4, 10-テトラデカジニエル=アセタート、(Z)-8-ドデセ

ニル=アセタート、(Z)-11-テトラデセニル=アセタート、(Z)-13-イコセン-10-オン、(Z)-8-ドデセニル=アセタート、(Z)-11-テトラデセニル=アセタート、(Z)-13-イコセン-10-オン、14-メチル-1-オクタデセン等のフェロモン剤と併用することも可能である。

5 以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定されるものではない。

尚、製剤例中、部とあるのは重量部を示す。

製剤例1.

第1表乃至第4表記載の化合物	10部
10 キシレン	70部
N-メチルピロリドン	10部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	10部
以上を均一に混合溶解して乳剤とする。	

15 製剤例2.

第1表乃至第4表記載の化合物	3部
クレー粉末	82部
珪藻土粉末	15部
以上を均一に混合粉碎して粉剤とする。	

20 製剤例3.

第1表乃至第4表記載の化合物	5部
ベントナイトとクレーの混合粉末	90部
リグニンスルホン酸カルシウム	5部
以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。	

25 製剤例4.

第1表乃至第4表記載の化合物	20部
カオリンと合成高分散珪酸	75部
ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物	5部

以上を均一に混合粉碎して水和剤とする。

試験例1. コナガ(*Plutella xylostella*)に対する殺虫試験

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼2日後に産下卵の付いたハクサイ実生を第1表乃至第4表に記載の化合物を有効成分とする薬剤を50
5 ppmに希釈した薬液に約30秒間浸漬し、風乾後に25℃の恒温室に静置した。薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、下記基準に従って判定を行った。1区10頭3連制

無処理区孵化虫数 - 処理区孵化虫数

$$10 \quad \text{補正死虫率} (\%) = \frac{\text{無処理区孵化虫数} - \text{処理区孵化虫数}}{\text{無処理区孵化虫数}} \times 100$$

判定基準. A . . . 死虫率 100%

B . . . 死虫率 99%~90%

15 C . . . 死虫率 89%~80%

D . . . 死虫率 79%~50%

上記試験の結果、B以上の殺虫活性を示した化合物は1-2, 1-4, 1-1
0, 1-14, 1-17, 1-20, 1-21, 1-26, 1-28, 1-33,
1-35, 1-41, 1-48, 1-52, 1-56~58, 1-65, 1-7
20 0, 1-73, 1-82, 1-103, 1-107, 1-108, 1-132,
1-133, 1-143, 1-145, 1-146, 1-163, 1-164,
3-2, 3-3, 3-4, 3-10, 3-12, 4-1, 4-4, 及び4-5で
あった。

試験例2. チャノコカクモンハマキ (*Adoxophyes* sp.)に対する殺虫試験

25 第1表乃至第4表に記載の化合物を有効成分とする薬剤を500 ppmに希釈した薬液にチャ葉を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレに入れ、チャノコカクモンハマキ幼虫を接種した後、25℃、湿度70%の恒温室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、試験例1の判定基準に従って判定を行った。1区10頭3連制

無処理区生存虫数 - 処理区生存虫数

$$\text{補正死虫率 (\%)} = \frac{\text{無処理区生存虫数}}{\text{無処理区生存虫数}} \times 100$$

5

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は1-52, 1-60, 1-103, 3-12, 3-28, 3-30及び3-31であった。

試験例3. ナミハダニ(*Tetranychus urticae*)に対する殺ダニ試験

インゲン葉で直径2cmのリーフディスクを作成し、湿潤濾紙上に置き、そこ
10 へ雌成虫を接種した後、第1表乃至第4表に記載の化合物を有効成分とする薬剤
を500 ppmに希釈した薬液50mlをターンテーブル上で均一に散布し、散
布後25°Cの恒温室に静置した。薬剤処理2日後に死亡虫数を調査し、試験例1
の判定基準に従って判定した。1区10頭2連制

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は1-22, 1-23, 1-25,
15 1-26, 1-34, 1-39, 1-40, 1-51, 1-52, 1-54, 1-60～
62, 1-65, 1-70～73, 1-78, 1-81, 1-82, 1-103, 1-
104, 1-106～109, 1-119, 1-132, 1-143, 1-146,
3-13, 3-21, 3-30～32及び4-3であった。

試験例4. モモアカアブラムシ(*Myzus persicae*)に対する殺虫試験

20 直径8cm、高さ8cmのプラスチックポットにハクサイを植え、モモアカア
ブラムシを繁殖させた後、第1表乃至第4表に記載の化合物を有効成分とする薬
剤を500 ppmに希釈した薬液を茎葉部に十分に散布した。風乾後、ポットを
温室内に静置し、薬剤散布6日後に各ハクサイに寄生しているモモアカアブラム
シ数を調査し、防除価を算出し、下記基準に従って判定を行った。

25

$$\text{防除価 (\%)} = 100 - [(T \times C_a) / (T_a \times C)] \times 100$$

T_a : 処理区の散布前寄生虫数

T : 処理区の散布後寄生虫数

C_a : 無処理区の散布前寄生虫数
 C : 無処理区の散布後寄生虫数

判定基準

5 A : 防除率 100%
 B : 防除率 99~90%
 C : 防除率 89~80%
 D : 防除率 79~50%

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は1-4, 1-8, 1-25, 1-10
 10 35, 1-41, 1-52, 1-65, 1-81, 1-87, 1-106~108, 1-146, 3-27, 3-13, 3-34及び4-1であった。

試験例5. オオムギうどんこ病に対する防除試験

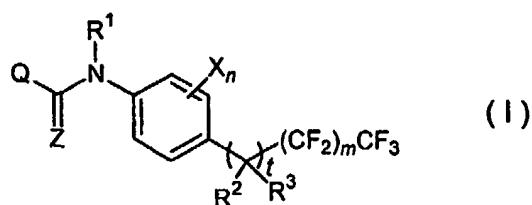
ポット植えのオオムギ(1葉期)にうどんこ病菌(*Erysiphe graminis hordei*)
 の胞子ふりかけて接種し、1日後に第1表、第3表又は第4表に記載の化合物を
 15 有効成分とする薬剤を200 ppmに希釀した薬液を散布し、25°Cの恒温室に
 静置した。接種1週間後にその病斑面積を調査し、無処理区と対比して下記の基
 準で防除効果を判定した。

判定基準 A : 防除率 100~95%
 B : 防除率 94~80%
 C : 防除率 79~60%
 D : 防除率 59~0%

上記試験の結果、B以上の活性を示した化合物は1-5, 1-12, 1-23, 1-30, 1-45, 1-47, 1-52, 1-54, 1-83, 1-133, 3-30, 3-31及び4-3であった。

請求の範囲

1. 一般式(I)



5 (式中、R¹は水素原子、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルカルボニル基、ハロC₁-C₆アルキルカルボニル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

R²は水素原子、ハロゲン原子又はハロC₁-C₆アルキル基を示す。

15 R³は水素原子、ハロゲン原子、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、シアノ基、ヒドロキシ基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルコキシC₁-C₃アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシC₁-C₃アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₃アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルキルチオC₁-C₃アルコキシ基、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₃アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₃アルコキシ基、C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₃アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₃アルコキシ基、モノC₁-C₆アルキルアミノC₁-C₃アルコキシ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノC₁-C₃アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、アミノ基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、

フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6
 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 ア
 ルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキル
 5 スルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ
 基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシ
 カルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニ
 ルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 -
 C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アル
 10 コキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキ
 ルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスル
 ホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、
 同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカル
 ボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニル
 15 スルフィニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6
 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 ア
 ルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキル
 スルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ
 20 基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシ
 カルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル
 基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、
 ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、
 ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、
 25 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6
 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキ
 ルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 ア
 ルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスル
 ホニル基、フェニル C_1 - C_6 アルコキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハ

ロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルC₁-C₆アルコキシ基を示す。

t は 0 または 1 を示し、 m は 0 ~ 6 の整数を示す。

10 t が 0 のとき、X は同一又は異なっても良く、C₂–C₈アルキル基、C₁–C₈アルキル基、C₁–C₆アルキルチオ基、C₁–C₆アルキルスルフィニル基、C₁–C₆アルキルスルホニル基、C₁–C₆アルコキシ基、C₁–C₆アルキル基、モノC₁–C₆アルキルアミノC₁–C₆アルキル基又は同一若しくは異なっても良いジC₁–C₆アルキルアミノC₁–C₆アルキル基を示し、n は 1 ~ 4 の整数を示す。

t が 1 のとき、X は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、C₁–C₈アルキル基、ハロC₁–C₈アルキル基、C₂–C₈アルケニル基、ハロC₂–C₈アルケニル基、C₂–C₈アルキニル基、ハロC₂–C₈アルキニル基、C₃–C₆シクロアルキル基、C₃–C₆シクロアルキルC₁–C₆アルキル基、C₁–C₈アルコキシ基、ハロC₁–C₈アルコキシ基、C₁–C₆アルキルチオ基、C₁–C₆アルキルスルフィニル基、C₁–C₆アルキルスルホニル基、モノC₁–C₆アルキルアミノ基、同一又は異なるても良いジC₁–C₆アルキルアミノ基、C₁–C₈アルキルカルボニル基、ハロC₁–C₈アルキルカルボニル基、C₁–C₈アルキルチオカルボニル基、ハロC₁–C₈アルキルチオカルボニル基、C₁–C₆アルキルカルボニルC₁–C₆アルキル基、ハロC₁–C₆アルキルカルボニルC₁–C₆アルキル基、C₁–C₆アルキルチオカルボニルC₁–C₆アルキル基、ハロC₁–C₆アルキル基、ハロC₁–C₆アルキルチオカルボニルC₁–C₆アルキル基、C₁–C₆

25 アルコキシC₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルコキシC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルチオC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルスルフィニルC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルキルスルホニルC₁-C₆アルキル基、モノC₁-C₆アルキルアミノC₁-C₆アルキル基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノC₁-C₆アルキル基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、

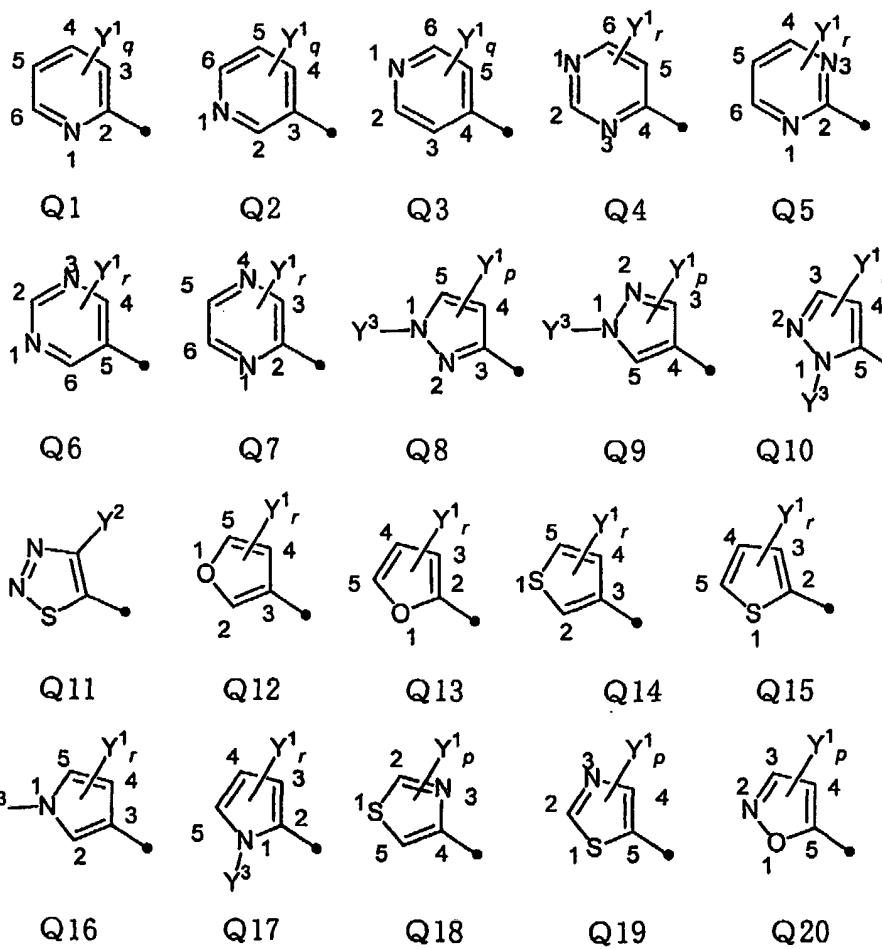
ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、
ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、
 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6
アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキ
5 ルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 ア
ルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、
フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6
アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 ア
10 ルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキ
ルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ
基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシ
カルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニ
ルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-
15 C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アル
コキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキ
ルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスル
ホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、
同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカル
20 ボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、複素環基
又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-
 C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アル
コキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキ
ルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスル
25 ホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、
同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカル
ボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示し、nは1～
4の整数を示す。

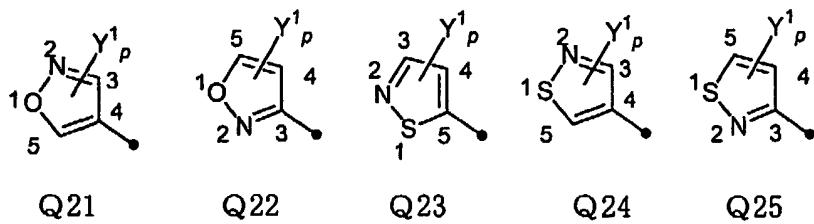
又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、

該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁~C₆アルキル基、ハロC₁~C₆アルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、ハロC₁~C₆アルコキシ基、C₁~C₆アルキルチオ基、ハロC₁~C₆アルキルチオ基、C₁~C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルフィニル基、C₁~C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルホニル基、モノC₁~C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁~C₆アルキルアミノ基又はC₁~C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。又、XはR¹と結合して、1~2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い5~8員環を形成することができる。

10 Zは酸素原子又は硫黄原子を示す。

QはQ1~Q25で表される置換基を示す。





(式中、Y¹は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₂-C₆アルケニル基、ハロC₂-C₆5アルケニル基、C₂-C₆アルキニル基、ハロC₂-C₆アルキニル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、フ10エニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、15同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィ20ニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、25ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロ

C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なつても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

又、芳香環上の隣接した2個の Y^1 は一緒になって縮合環を形成することがで
5 き、該縮合環は同一又は異なつても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6
アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 ア
ルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキ
スルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ
10 基、同一又は異なつても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシ
カルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。

Y^2 は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6
アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキ
ルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-
15 C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキ
ルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なつても良いジ C_1-
 C_6 アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なつても良く、ハロゲン原子、
シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アル
コキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アル
20 キルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニ
ル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ
 C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なつても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基
又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置
換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なつても良く、ハロゲン原子、シアノ
25 基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ
基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチ
オ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、
 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6
アルキルアミノ基、同一又は異なつても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-

C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、

5 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

10 Y^3 は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

15 p は0~2の整数を示し、 q は0~4の整数を示し、 r は0~3の整数を示す。)を示す。}

20 で表される置換アニリド誘導体。

2. 一般式(I-1)

(I-1)

{式中、 R^1 は水素原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルカルボニル基又はハロ C_1-C_6 アルキルカルボニル基を示す。

25 R^2 は水素原子、ハロゲン原子又はハロ C_1-C_6 アルキル基を示す。

R^3 は水素原子、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、

シアノ基、ヒドロキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_3 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_3 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_3 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_3 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_3 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_3 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_3 アルコキシ基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_3 アルコキシ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_3 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基を示す。

mは0～6の整数を示す。

Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、 C_1-C_8 アルキル基、ハロ C_1-C_8 アルキル基、 C_2-C_8 アルケニル基、ハロ C_2-C_8 アルケニル基、 C_2-C_8 アルキニル基、ハロ C_2-C_8 アルキニル基、 C_3-C_6 シクロアルキル基、 C_3-C_6 シクロアルキル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_8 アルコキシ基、ハロ C_1-C_8 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、 C_1-C_8 アルキルカルボニル基、ハロ C_1-C_8 アルキルカルボニル基、 C_1-C_8 アルキルチオカルボニル基、ハロ C_1-C_8 アルキルチオカルボニル基、 C_1-C_6 アルキルカルボニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオカルボニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルキル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、

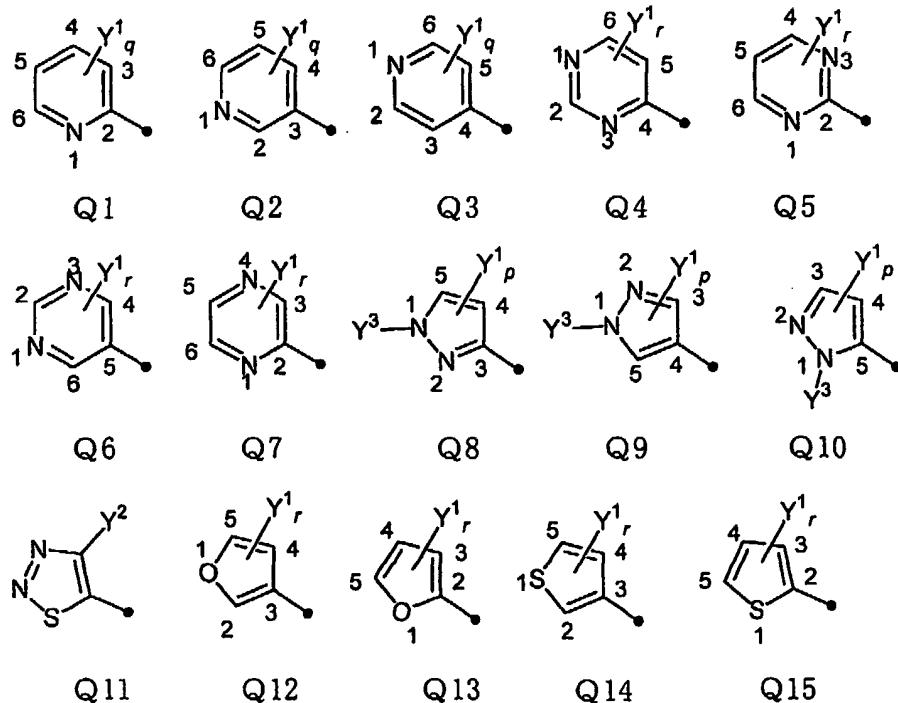
ルキルスルフィニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルフィニル基、C₁~C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルホニル基、モノC₁~C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁~C₆アルキルアミノ基又はC₁~C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示し、n 5 は1~4の整数を示す。

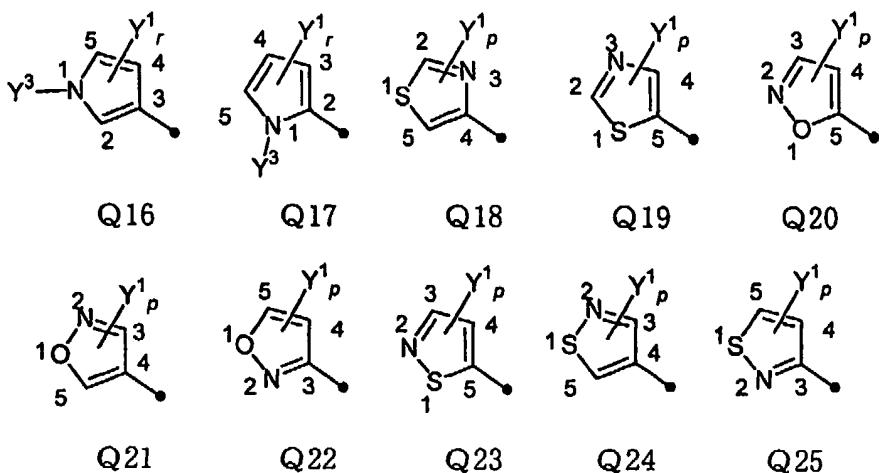
又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁~C₆アルキル基、ハロC₁~C₆アルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、ハロC₁~C₆アルコキシ基、C₁~C₆アルキルチオ基、ハロC₁~C₆アルキルチオ基、C₁~C₆アルキ10 ルスルフィニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルフィニル基、C₁~C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルホニル基、モノC₁~C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁~C₆アルキルアミノ基又はC₁~C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。又、XはR¹と結合して、1~2個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子15 により中断されても良い5~8員環を形成することができる。

Zは酸素原子又は硫黄原子を示す。

QはQ 1~Q 25で表される置換基を示す。

20





5 (式中、Y¹は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
 C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₂-C₆アルケニル基、ハロC₂-C₆
 アルケニル基、C₂-C₆アルキニル基、ハロC₂-C₆アルキニル基、C₁-C₆アルコ
 キシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキ
 ルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル
 基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-
 C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、フ
 ェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-
 C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アル
 コキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキ
 15 ルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスル
 ホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、
 同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカル
 ボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、
 同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキ
 20 ル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、
 C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィ
 ニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、
 ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異
 なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基か
 25 ら選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若し

くは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

又、芳香環上の隣接した2個のY¹は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。

Y²は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ

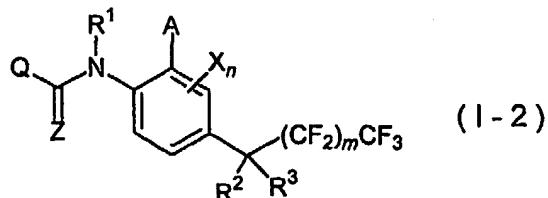
基、ハロ C_1 ~ C_6 アルコキシ基、 C_1 ~ C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 ~ C_6 アルキルチオ基、 C_1 ~ C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 ~ C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 ~ C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 ~ C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 ~ C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 ~ C_6 アルキルアミノ基又は C_1 ~
 5 C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 ~ C_6 アルキル基、ハロ C_1 ~ C_6 アルキル基、 C_1 ~ C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 ~ C_6 アルコキシ基、 C_1 ~ C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 ~ C_6 アルキルチオ基、 C_1 ~ C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 ~ C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 ~ C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 ~ C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 ~ C_6 アルキ
 10 ルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 ~ C_6 アルキルアミノ基又は C_1 ~ C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

Y^3 は水素原子、 C_1 ~ C_6 アルキル基、ハロ C_1 ~ C_6 アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 ~ C_6 アルキル基、ハロ C_1 ~ C_6 アルキル基、 C_1 ~ C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 ~ C_6 アルコキシ基、 C_1 ~ C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 ~ C_6 アルキルチオ基、 C_1 ~ C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 ~ C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 ~ C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 ~ C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 ~ C_6 アルキルアミノ基、同一
 20 又は異なっても良いジ C_1 ~ C_6 アルキルアミノ基又は C_1 ~ C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

p は0~2の整数を示し、 q は0~4の整数を示し、 r は0~3の整数を示す。)を示す。)

で表される置換アニリド誘導体。

25 3. 一般式(I-2)

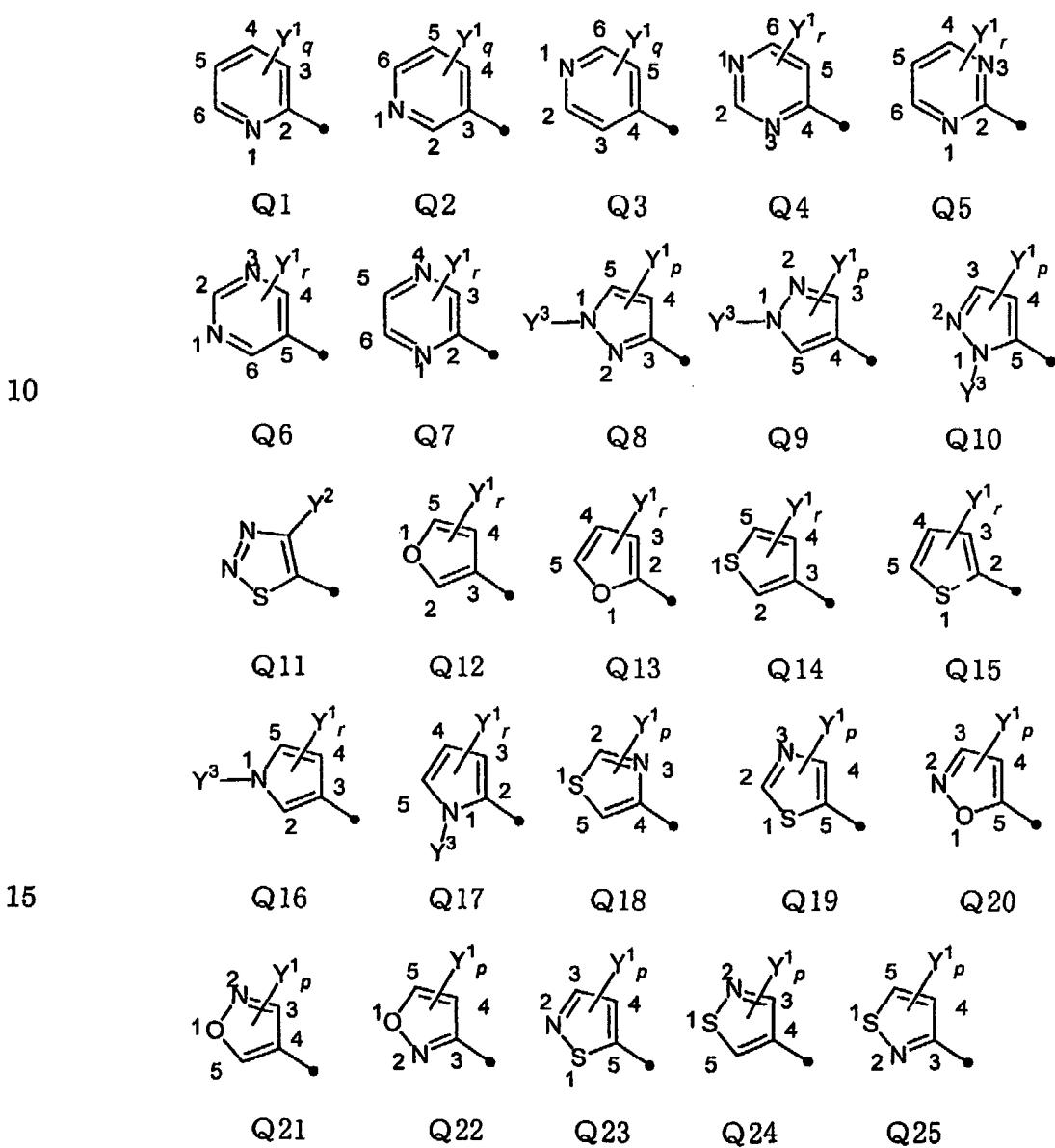


C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルキル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基又は同一若しくは異なっても良いジ

5 C_1-C_6 アルキルアミノ C_1-C_6 アルキル基を示し、 n は0~3の整数を示す。

Z は酸素原子又は硫黄原子を示す。

QはQ1~Q25で表される置換基を示す。



(式中、 Y^1 は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_2-C_6 アルケニル基、ハロ C_2-C_6

アルケニル基、 C_2 - C_6 アルキニル基、ハロ C_2 - C_6 アルキニル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - 5 C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、 10 ホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 15 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、 20 ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なつても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選 25 択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

又、芳香環上の隣接した2個の Y^1 は一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6

アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキ

ルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキ

ルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ

基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-C₆アルコキシ

5 カルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。

Y²は、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆

アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキ

ルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-

10 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキ

ルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-

C₆アルキルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、

シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アル

コキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アル

キルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニ

15 ル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノ

C₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基

又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置

換フェニル基、フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ

基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ

20 基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチ

オ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、

C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆

アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基又はC₁-

C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノ

25 キシ基、複素環基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、

ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、

ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、

C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆

アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキ

ルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁~C₆アルキルアミノ基又はC₁~C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換複素環基を示す。

Y³は水素原子、C₁~C₆アルキル基、ハロC₁~C₆アルキル基、フェニル基又は5 同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁~C₆アルキル基、ハロC₁~C₆アルキル基、C₁~C₆アルコキシ基、ハロC₁~C₆アルコキシ基、C₁~C₆アルキルチオ基、ハロC₁~C₆アルキルチオ基、C₁~C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルフィニル基、C₁~C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁~C₆アルキルスルホニル基、モノC₁~C₆アルキルアミノ基、同一10 又は異なっても良いジC₁~C₆アルキルアミノ基又はC₁~C₆アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

pは0~2の整数を示し、qは0~4の整数を示し、rは0~3の整数を示す。)を示す。}で表される置換アニリド誘導体。

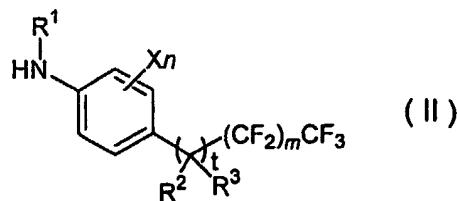
4. 一般式(I-2)において、R¹、R²、R³、A、X、Z、n、mは請求15 項3と同じくし、QがQ9、Q14、Q15である請求項3記載の置換アニリド誘導体。

5. 請求項1乃至4いずれか1項記載の置換アニリド誘導体を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用薬剤。

6. 農園芸用薬剤が農園芸用殺虫剤、殺菌剤又は殺ダニ剤である請求項5記20 載の農園芸用薬剤。

7. 有用植物から有害生物を防除するために、請求項5又は6いずれか1項記載の農園芸用薬剤の有効量を対象植物又は土壤に処理することを特徴とする農園芸用薬剤の使用方法。

8. 一般式(II)



(式中、R¹は水素原子、C₁~C₆アルキル基、ハロC₁~C₆アルキル基、フェニ

ル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6
 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 ア
 ルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキル
 5 スルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ
 基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシ
 カルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。

R^2 は水素原子、ハロゲン原子又はハロ C_1-C_6 アルキル基を示す。

R^3 は水素原子、ハロゲン原子、 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、
 10 シアノ基、ヒドロキシ基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6
 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルコキシ C_1-C_6 アルコキシ基、
 C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ C_1-C_6 アル
 コキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アル
 キルスルフィニル C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アル
 15 コキシ基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル C_1-C_6 アルコキシ基、モノ C_1-C_6 アル
 キルアミノ C_1-C_6 アルコキシ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキル
 アミノ C_1-C_6 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ
 基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6
 アルキルスルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、アミノ基、モノ
 20 C_1-C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基、
 フェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、
 C_1-C_6 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6
 アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 ア
 ルキルスルフィニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1-C_6 アルキル
 25 スルホニル基、ハロ C_1-C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1-C_6 アルキルアミノ
 基、同一又は異なっても良いジ C_1-C_6 アルキルアミノ基又は C_1-C_6 アルコキシ
 カルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニ
 ルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1-C_6
 アルキル基、ハロ C_1-C_6 アルキル基、 C_1-C_6 アルコキシ基、ハロ C_1-C_6 アル

コキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、フェニルスルフィニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルフィニル基、フェニルスルホニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニルスルホニル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニル C_1 - C_6 アルコキシ基を示す。

t は1を示し、 m は0から6の整数を示す。

X は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、 C_1 - C_8 アルキル基、

ハロ C_1 - C_8 アルキル基、 C_2 - C_8 アルケニル基、ハロ C_2 - C_8 アルケニル基、 C_2 - C_8 アルキニル基、ハロ C_2 - C_8 アルキニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_8 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_8 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキ

5 ルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニル C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルチオカルボニル C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルチオ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルスル

10 フィニル C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル C_1 - C_6 アルキル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ C_1 - C_6 アルキル基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ C_1 - C_6 アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ

15 基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示し、nは1~4の整数を示す。

20 又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒にになって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスル

25 ホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有することもできる。)で表される置換アニリン誘導体。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP02/05285

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

Int.Cl⁷ C07D231/14, 213/81, 285/06, 239/28, 307/68, 277/56, 261/18, 275/02, 333/40, 207/416, 213/82, 333/38, C07C211/52, 215/68, 217/76, A01N37/22, 43/40, 43/56

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

Int.Cl⁷ C07D231/14, 213/81, 285/06, 239/28, 307/68, 277/56, 261/18, 275/02, 333/40, 207/416, 213/82, 333/38, C07C211/52, 215/68, 217/76, A01N37/22, 43/40, 43/56

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 01/23356 A (Bayer AG), 05 April, 2001 (05.04.01), Patentansprüche & DE 19946852 A	1-8

Further documents are listed in the continuation of Box C.

See patent family annex.

- * Special categories of cited documents:
- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the international filing date
- "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search
04 July, 2002 (04.07.02)

Date of mailing of the international search report
16 July, 2002 (16.07.02)

Name and mailing address of the ISA/
Japanese Patent Office

Authorized officer

Facsimile No.

Telephone No.

A. 発明の属する分野の分類 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl' C07D 231/14, 213/81, 285/06, 239/28, 307/68, 277/5
6, 261/18, 275/02, 333/40, 207/416, 213/82, 333/38, C07C 211/
52, 215/68, 217/76, A01N 37/22, 43/40, 43/56

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料 (国際特許分類 (IPC))

Int. Cl' C07D 231/14, 213/81, 285/06, 239/28, 307/68, 277/5
6, 261/18, 275/02, 333/40, 207/416, 213/82, 333/38, C07C 211/
52, 215/68, 217/76, A01N 37/22, 43/40, 43/56

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース (データベースの名称、調査に使用した用語)

CA (STN), REGISTRY (STN), WPIDS (STN)

C. 関連すると認められる文献

引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
X	WO 01/23356 A (BAYER AKTIENGESELLSCHAFT) 200 1. 04. 05, Patentansprüche & DE 19946852 A	1-8

C欄の続きにも文献が列挙されている。

パテントファミリーに関する別紙を参照。

* 引用文献のカテゴリー

「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示す
もの
「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日
以後に公表されたもの
「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行
日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する
文献 (理由を付す)
「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献
「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

の日の後に公表された文献

「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって
出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論
の理解のために引用するもの
「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明
の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以
上の文献との、当業者にとって自明である組合せに
よって進歩性がないと考えられるもの
「&」同一パテントファミリー文献

国際調査を完了した日 04.07.02	国際調査報告の発送日 16.07.02
国際調査機関の名称及びあて先 日本国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号 100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 内藤 伸一 4P 8615 電話番号 03-3581-1101 内線 3492